

506, 909

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2003 年 9 月 12 日 (12.09.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/074501 A1

(51) 国際特許分類⁷: C07D 261/08, 413/04, 413/12, 417/04, 417/12, 413/06, A01N 43/80, 47/12, 47/18, 47/22, 47/28, 47/30, 47/32, 47/36, 47/38

(74) 代理人: 大家 邦久 (OHIE, Kunihisa); 〒103-0013 東京都中央区日本橋人形町 2 丁目 2 番 6 号 堀口第 2 ビル 7 階 大家特許事務所 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/02632

(22) 国際出願日: 2003 年 3 月 6 日 (06.03.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2002-61835 2002 年 3 月 7 日 (07.03.2002) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 株式会社エス・ディー・エス バイオテック (SDS BIOTECH K.K.) [JP/JP]; 〒105-0014 東京都港区芝 2 丁目 5 番 6 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 下園 典子 (SHI-MOZONO, Noriko) [JP/JP]; 〒300-2646 茨城県つくば市緑ヶ原 2 丁目 1 番 株式会社エス・ディー・エス バイオテック つくば研究所内 Ibaraki (JP). 和田 浩 (WADA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒300-2646 茨城県つくば市緑ヶ原 2 丁目 1 番 株式会社エス・ディー・エス バイオテック つくば研究所内 Ibaraki (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

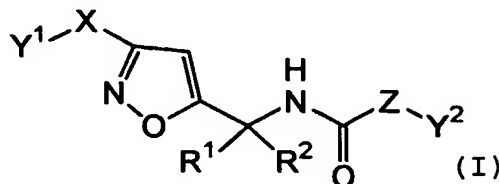
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: SUBSTITUTED ISOXAZOLE ALKYLAMINE DERIVATIVE AND AGRI- AND HORTICULTURAL FUNGICIDE

(54) 発明の名称: 置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体及び農園芸用殺菌剤



(57) Abstract: An agri- and horticultural fungicide comprising a substituted isoxazole alkylamine derivative of the general formula (I) as an effective ingredient exhibits a satisfactory plant disease control activity without cross with known drug tolerance bacilli. (I) wherein each of R¹ and R² represents, for example, hydrogen or a substituted or unsubstituted alkyl; X represents, for example, a single bond or an alkylene; Y¹ represents, for example, a substituted or unsubstituted lower alkyl, a substituted or unsubstituted cycloalkyl, a substituted or unsubstituted phenyl or a substituted or unsubstituted heteroaryl; Y² represents, for example, a substituted or unsubstituted cycloalkyl, a substituted or unsubstituted phenyl or a substituted or unsubstituted heteroaryl; and Z represents, for example, a substituted or unsubstituted alkylene, -O-(substituted or unsubstituted alkylene)- or -NR-(substituted or unsubstituted alkylene)-.

[続葉有]

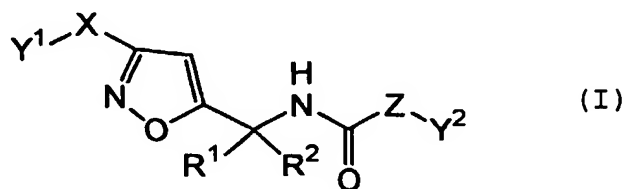


WO 03/074501 A1



(57) 要約:

一般式 (I) で示される置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤は、既知の薬剤耐性菌に交差することなく、かつ十分な植物病害防除活性を発揮する。



[式中、 R^1 及び R^2 は水素原子、(置換)アルキル等；Xは単結合、アルキレン等； Y^1 は(置換)低級アルキル、(置換)シクロアルキル、(置換)フェニル、(置換)ヘテロアリール等、 Y^2 は(置換)シクロアルキル、(置換)フェニル、(置換)ヘテロアリール等；Zは(置換)アルキレン、 $-O-$ ((置換)アルキレン)、 $-NR-$ ((置換)アルキレン)一等]

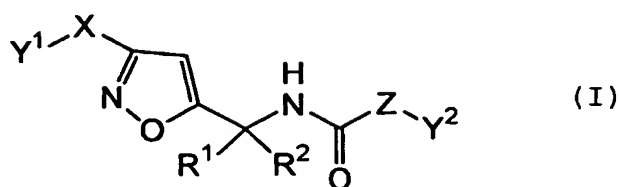
明細書

置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体及び農園芸用殺菌剤

技術分野

本発明は、

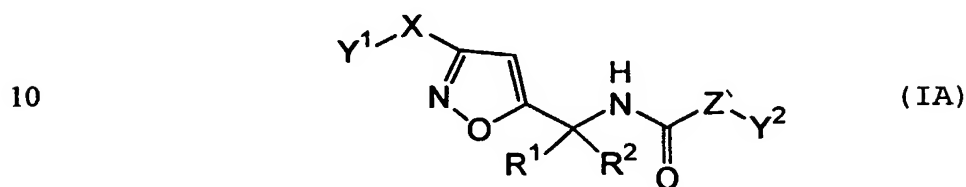
5 1) 一般式 (I)



(式中の記号は後記の通り。)

で示される新規な置換イソキサゾール誘導体及び

2) 一般式 (IA)



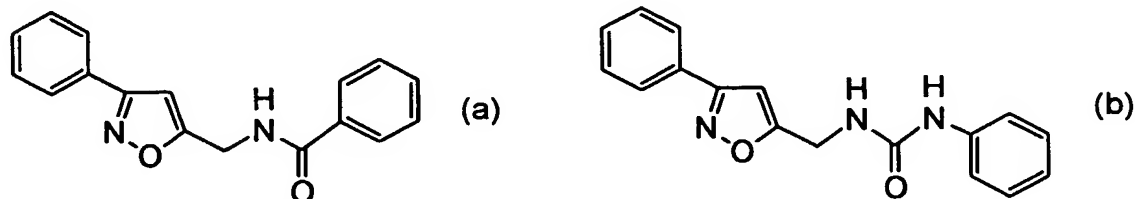
(式中の記号は後記の通り。)

で示される置換イソキサゾール誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関する。

15 背景技術

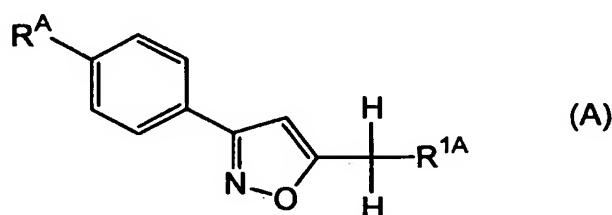
1) 特表平9-509951号公報、国際公開第9828282号、米国特許第5859257号明細書、英国特許第1067203号および欧州特許第277791号公報には置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体の化合物が開示されているが、殺菌活性についての記載はない。

2) J. C. S. Perkin Trans. I, 16, 1694-1696 (1976)には、下記化号物 (a) および (b) を出発原料としたスピロオキサゾリン環形成反応を行っているが、化合物 (a) および (b) の殺菌活性についての記載はない。



5

3) 特開昭 5 2 - 1 5 4 5 2 5 公報には、下記一般式 (A)



(式中、 R^A はクロル基、ブロム基、フルオロ基、トリフルオロメチル基または水素原子を表わし、 R^{1A} はブロム基、クロル基、イソチオシアナート基、アミノ基、アミノ・塩酸塩もしくは・臭化水素塩、 $-NHCSNH$ (C 1 ~ C 3) アルキル、 $-NHCOO$ (C 1 ~ C 3) アルキルまたは 3, 5, 7-トリアザー-1-アゾニアアダマンチルクロリドもしくはブロミドを表わす。) が、殺菌剤として、特にトマト疫病、マメうどんこ病、キュウリ炭疽病、イネいもち病、コムギ斑点病、ブドウ灰色かび病、リンゴ黒星病、ブドウ
15 ウベと病、テンサイ褐斑病に対して防除活性を示すことが示されている。しかし、この公報明細書に記載された化合物の殺菌剤としての活性は充分ではない。

農作物あるいは園芸作物の栽培においては、生産効率に重大な影響を与える様々な病害が知られており、例えば、稲作におけるいもち病及び紋枯病、

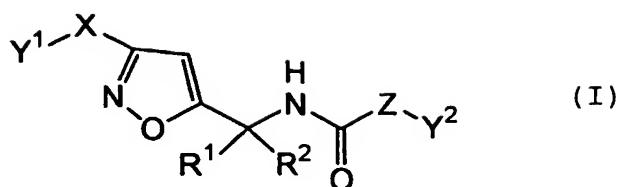
果樹、野菜及び穀類栽培におけるうどんこ病、べと病、及び灰色かび病などを重要病害として挙げることができる。

5 これら植物病原菌によって引き起こされる病害に関し、これまで各種殺菌剤が使用されてきている。しかしながら、従来使用された公知薬剤は、長年の使用によって耐性菌が発生し、十分な殺菌効果を得られず使用できなくな
たり、十分な殺菌効果を得るために他の薬剤と組み合わせて用いる必要があ
った。従って、農作物あるいは園芸作物の栽培分野では、従来の薬剤とは
化学構造の骨格が異なり、かつ十分な防除効果を発揮する新規な植物病害防
除性化合物の出現が要望されている。本発明は、上述したような従来技術に
10 伴う問題点を解決しようとするものである。本発明の目的は、従来の薬剤と
は化学構造の骨格が異なるために既知の薬剤耐性菌に交差することなく、か
つ十分な植物病害防除活性を発揮する新規な薬剤を提供することにある。

発明の開示

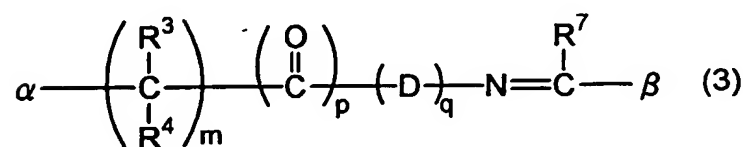
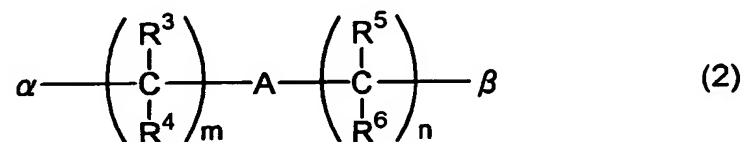
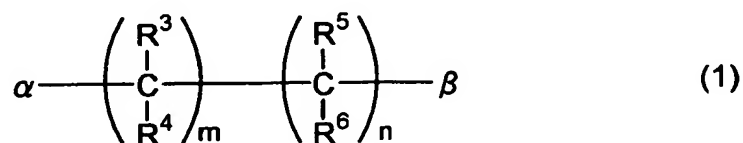
15 本発明者らは、上記の目的を達成するために、これまで植物病害防除活性
の知られていない新規の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体を合成し
その植物病害防除活性と有用性について鋭意検討した。その結果、後記の一
般式 (I) または一般式 (I A) で示される置換イソキサゾールアルキルア
ミン誘導体が植物に薬害を与えることなく優れた植物病原菌防除効果を有す
20 ることを見出した。

すなわち、本発明は下記一般式 (I) で示される置換イソキサゾールアル
キルアミン誘導体および下記一般式 (I A) で示される置換イソキサゾール
アルキルアミン誘導体を活性成分として含有することを特徴とする農園芸用
病害防剤に関する。



- 5 式中、 R^1 及び R^2 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基またはシアノ基を表わし、または R^1 と R^2 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

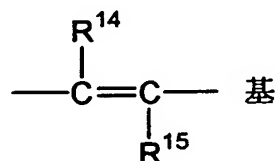
Xは次式(1)、(2)または(3)



- 10 (式中、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基
- 15 を表わし、または R^3 と R^4 及び R^5 と R^6 が一緒になって置換されていても

よいシクロアルキル基を形成してもよく、

- Aは、酸素原子、硫黄原子、 $-S(O)-$ 基、 $-S(O)_2-$ 基、 $-NR^{12}$ 基（基中、 R^{12} は水素原子または低級アルキル基を表わす。）、カルボニル基、 $-NH-CO-$ 基、 $-CO-NH-$ 基、 $-C\equiv C-$ 基、 $-NH-CO$
 5 $NH-$ 基、 $-O-CONH-$ 基、 $-HC=N-$ 基または



（基中、 R^{14} および R^{15} はそれぞれ水素原子または低級アルキル基を表わす。）を表わし、

m及びnはそれぞれ0または1～3の整数を表わし、

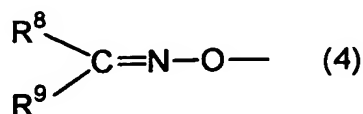
- 10 p及びqはそれぞれ0または1を表わし、

R^7 は、水素原子または低級アルキル基を表わし、

Dは酸素原子または $-NH-$ 基を表わす。

なお、 α は Y^1 側に結合し、 β はイソキサゾール環側に結合するものとする。）で示される基を表わし、

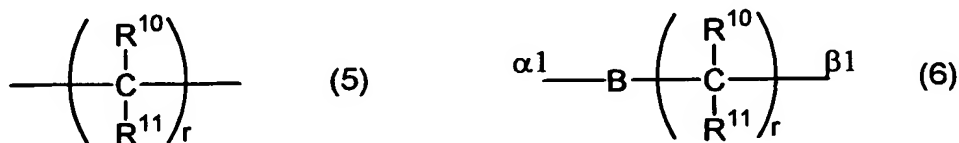
- 15 Y^1 は、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘ
 20 テロ環または次式（4）



(式中、 R^8 及び R^9 はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいフェニル基を表わし、または R^8 と R^9 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよい。)を表わし、

- 5 Y^2 は置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環を表わし、

- 10 Zは、次式(5)または(6)



- (式中、 R^{10} 及び R^{11} は、同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^{10} と R^{11} が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

- 15 r は0または1～3の整数を表わし、
Bは酸素原子、硫黄原子または $-NR^{13}-$ 基(式中、 R^{13} は水素原子または低級アルキル基を表わす。)を表わす。

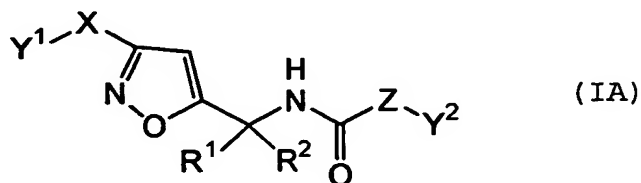
20 なお、 $\alpha 1$ 及び $\beta 1$ はいずれが Y^2 側に結合してもよい。)で示される基を表わす。

ただし、以下の(1)～(3)を除く：

(1) Xが単結合(式(1)においてm及びnが0の場合)であり、Y¹が4-ヒドロキシ-3, 5-ジ-tert-ブチルフェニル基を表わす化合物、

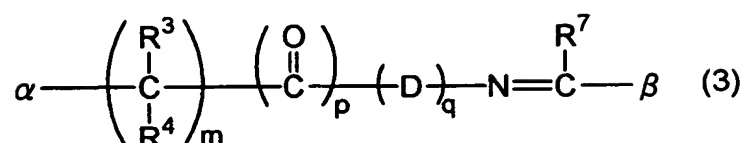
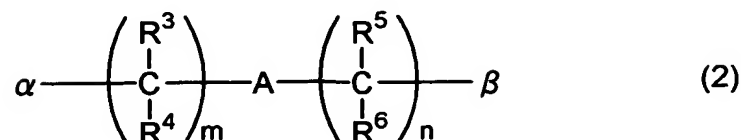
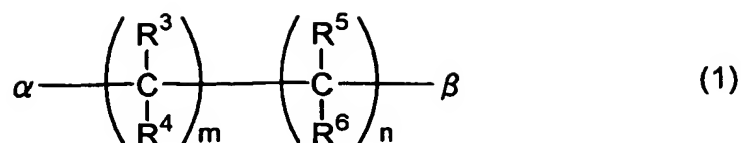
(2) (2-1) Zが単結合(式(5)においてrが0の場合)であるとき、
 もしくは(2-2) ZがNH基(式(6)においてr=0でBが-NH-基を表わす場合)のとき、R¹及びR²が水素原子を表わし、Xが単結合(式(1)においてm及びnが0の場合)であり、Y¹及びY²が共に無置換のフェニル基を表わす化合物、

(3) R¹及びR²が水素原子を表わし、Zが単結合(式(5)においてrが0の場合)を表わし、Y²が置換されていてもよい4-ヒドロキシシンノリン-3-イル基を表わす化合物。



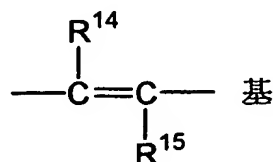
式中、R¹及びR²は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基またはシアノ基を表わし、またはR¹とR²が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

Xは次式(1)、(2)または(3)



(式中、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^3 と R^4 及び R^5 と R^6 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

Aは、酸素原子、硫黄原子、 $-S(O)-$ 基、 $-S(O)_2-$ 基、 $-NR^{12}$ 基（基中、 R^{12} は水素原子または低級アルキル基を表わす。）、カルボニル基、 $-NH-CO-$ 基、 $-CO-NH-$ 基、 $-C \equiv C-$ 基、 $-NH-CO-NH-$ 基、 $-O-CONH-$ 基、 $-HC=N-$ 基または



(基中、 R^{14} および R^{15} はそれぞれ水素原子または低級アルキル基を表わす。)を表わし、

m及びnはそれぞれ0または1～3の整数を表わし、

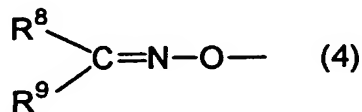
p及びqはそれぞれ0または1を表わし、

R⁷は、水素原子または低級アルキル基を表わし、

Dは酸素原子または—NH—基を表わす。

- 5 なお、αはY¹側に結合し、βはイソキサゾール環側に結合するものとする。)で示される基を表わし、

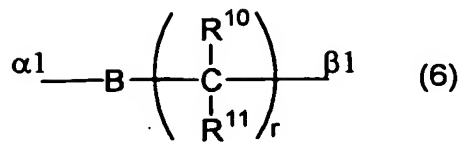
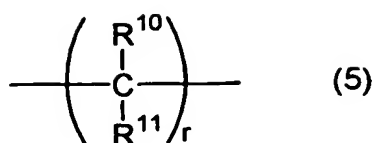
- Y¹は、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、
 10 置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環または次式(4)



- (式中、R⁸及びR⁹はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいフェニル基を表わし、またはR⁸とR⁹が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよい。)を表わし、
 15

- Y²は置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環を表わし、
 20

Zは、次式(5)または(6)



(式中、 R^{10} 及び R^{11} は、同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ

5 基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^{10} と R^{11} が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

r は0または1～3の整数を表わし、

Bは酸素原子、硫黄原子または $-NR^{13}-$ 基(式中、 R^{13} は水素原子または低級アルキル基を表わす。)を表わす。

10

なお、 $\alpha 1$ 及び $\beta 1$ はいずれが Y^2 側に結合してもよい。)で示される基を表わす。

[本発明化合物]

一般式(I)または(IA)中、低級アルキル基とは、炭素数1～6のアルキル基であり、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル

15 またはそれらの異性体基が挙げられる。

低級アルケニル基とは、二重結合を1～3個有する炭素数2～6のアルケニル基であり、ビニル、プロペニル、ブテニル、ブタンジエニル、ヘキサントリエニル、またはそれらの異性体基が挙げられる。

低級アルキニル基とは、三重結合を1～3個有する炭素数2～6のアルキニル基であり、例えばエチニル、プロピニル、ペンチニル、ヘキシニルまたはそれらの異性体基が挙げられる。

20

シクロアルキル基とは、炭素数3～8のシクロアルキル基であり、シクロ

プロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘブチル、シクロオクチル基が挙げられる。

シクロアルケニル基とは、炭素数 3 ～ 8 のシクロアルケニル基であり、例えばシクロプロピニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘブテニル、シクロオクテニルまたはそれらの異性体基が挙げられる。

低級アルコキシ基とは、炭素数 1 ～ 6 のアルコキシ基であり、メチルオキシ基、エチルオキシ基、プロピルオキシ基、ブチルオキシ基、ペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基またはそれらの異性体基が挙げられる。

10 低級アルコキシカルボニル基とは、炭素数 1 ～ 6 のアルコキシカルボニル基であり、メチルオキシカルボニル基、エチルオキシカルボニル基、プロピルオキシカルボニル基、ブチルオキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基、ヘキシルオキシカルボニル基またはそれらの異性体基が挙げられる。

15 低級アルキルチオ基とは、炭素数 1 ～ 6 のアルキルチオ基であり、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、ブチルチオ基、ペンチルチオ基、ヘキシルチオ基またはそれらの異性体基が挙げられる。

ハロゲン原子とは、フッ素、塩素、臭素、またはヨウ素原子である。

ヘテロアリール基とは、環形成原子として酸素原子、硫黄原子、窒素原子等のヘテロ原子を 1 ～ 3 個有する芳香族性を示す単環または二環式のヘテロ環であり、例えばピロール、ピラゾール、イミダゾール、トリアゾール、ピリジン、ピリミジン、トリアジン、フラン、チオフェン、チアゾール、オキサゾール、イソキサゾール、イソチアゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾオキサゾール、インダゾール、インドール、キノリン、プリン、プテリジン環等が挙げられる。

25 脂肪族ヘテロ環は、環形成原子として酸素原子、硫黄原子、窒素原子等の

ヘテロ原子を1～3個有する5～6員環の脂肪族ヘテロ環であり、例えばピロリジン環、ピペリジン環、ピペラジン環、テトラヒドロピラン環、テトラヒドロフラン環、モルホリン環、ジオキサン等が挙げられる。

置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロアルケニル基、置換されていてもよい低級アルコキシ基、置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環は、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、置換されていてもよいフェニル基、低級アシル基、低級アシルオキシ基から選ばれる1または2以上の置換基で置換されていてもよい。

置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェニルオキシ基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基は、ハロゲン原子や低級アルコキシ基等で置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、ハロゲン原子等で置換されていてもよい低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルカンスルフィニル基、低級アルカンスルホニル基、 $R^{16}-NHCO-$ 基、 $R^{16}-CONH-$ 基（基中、 R^{16} は水素原子または低級アルキル基を表わす。）、 $R^{17}O-NHCO-$ 基（基中、 R^{17} は低級アルキル基を表わす。）、 $R^{18}-CO-$ 基（基中、 R^{18} はハロゲン原子等で置換されていてもよい炭化水素基（例えば低級アルキル基、フェニル基等）を表わす。）、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、置換されていてもよいシクロアルキル基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、 $R^{19}O-N=C(R^{20})-$ 基（基中、 R^{19} は水素原子または低級アルキル基を表わし、 R^{20} は水素原子、低級アルキル基またはアミノ基を表わす。）、脂肪族ヘテロシクロ環基、低級アルキルカルボ

- ニルヒドラジノ基、低級アルキルオキシカルボニルヒドラジノ基、ホルミル基、 $\text{H}_2\text{NN}=\text{C}(\text{R}^{21})$ - 基、 $\text{R}^{22}(\text{O})\text{CHNN}=\text{C}(\text{R}^{21})$ - 基（基中、 R^{21} および R^{22} は水素原子または低級アルキル基を表わす。）、水酸基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいフェニルオキシ基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、ハロゲン原子、シアノ基、及びニトロ基から選ばれる1または2以上の置換基で置換されていてもよく、また隣り合う置換基が一緒になって置換されていてもよい環状アルキル基や置換されていてもよい環状エーテル基を形成してもよい。
- 10 好ましいXとしては、前記式（1）においてはm及びnがそれぞれ0または1であり、より具体的には $m=n=0$ （単結合）、 $m+n$ が1（置換されていてもよいメチレン基）または $m=n=1$ （置換されていてもよいエチレン基）である。前記式（2）においてはm及びnがそれぞれ0または1が好ましく、 $m=n=0$ （A）、 $m=1$ で $n=0$ 、または $m=0$ で $n=1$ がより
- 15 好ましく、 $m=n=0$ （A）または $m=0$ で $n=1$ がさらに好ましい。前記式（3）においては、 $-(\text{CO})_p-(\text{D})_q-$ として、単結合、 $-\text{O}-$ 基または $-\text{CONH}-$ 基が好ましい。
- 好ましいZとしては、前記式（5）及び（6）においてrが0または1の基であり、さらに好ましくは単結合、 $-\text{CH}(\text{R}^{10a})-$ 基（ R^{10a} は水素原子、C1～3アルキル基、ハロゲン原子、シアノ基を表わす。）、 $-\text{O}-$ 基、 $-\text{NH}-$ 基、 $-\text{N}(\text{CH}_3)-$ 基、 $-\text{O}-\text{C}(\text{R}^{11a})_2-$ 基、 $-\text{C}(\text{R}^{11a})_2-\text{O}-$ 基、 $-\text{NH}-\text{C}(\text{R}^{11a})_2-$ 基（ R^{11a} は互いに独立して水素原子、C1～3アルキル基を表わす。）である。
- 20 好ましい Y^1 としては、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、置換さ

れていてもよいヘテロアリール基等が挙げられる。

好ましい Y^2 としては、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、及び置換されていてもよいヘテロアリール基であり、特に好ましくは、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基である。

本発明の一般式 (I) または (I A) の化合物として、好ましくは以下に示すものが挙げられる。

[1] R^1 及び R^2 が互いに独立して、それぞれ水素原子、または置換されていてもよい低級アルキル基を表わす置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[2] Z が酸素原子であり (式 (6) において r が 0 で B が酸素原子の場合)、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす前項 1 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[3] Z が $-NR^{13}-$ 基 (基中、 R^{13} は、水素原子または低級アルキル基を表わす。) (式 (6) において r が 0 で B が $-NR^{13}-$ 基の場合) を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす前項 1 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[4] X 及び Z が単結合 (式 (1) において m 及び n が 0 であり、式 (5) において r が 0 の場合) であり、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす前項 1 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[5] X が式 (1) で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6

が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、 $m+n$ が1、2または3である前項1に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[6] Xが式(2)で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、 n が1または2であり、 $m+n$ が1、2または3である前項1に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[7] Xが式(2)で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、 n が0であり、 m が0、1または2である前項1に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[8] Xが式(3)で示される基を表わし、基中の R^3 及び R^4 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 $m=0$ 、1または2を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす前

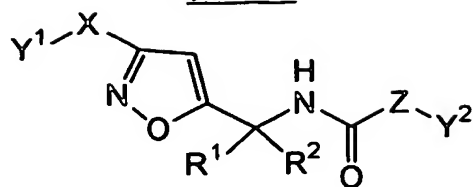
項 1 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

[9] Y^1 がハロゲン原子で置換されたメチル基を表わし、 Z が単結合 (式 (1) において m および n が 0 である場合) である前項 1 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

- 5 次一般式 (I) で示される本発明化合物の代表例を表 1 - 1 ~ 表 4 - 8 に示すが、本発明化合物はこれらに限定されるものではない (化合物番号は明細書を通じて同一の番号を使用する。)

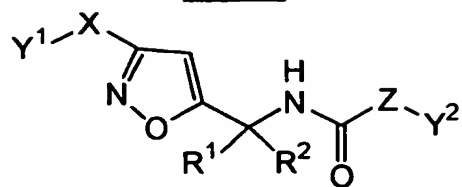
表中、 Me はメチル基を表し、 Et はエチル基を表わし、 $n-Pr$ はノルマルプロピル基を表わし、 $i-Pr$ はイソプロピル基を表わし、 $n-Bu$ は
10 ノルマルブチル基を表わし、 $i-Bu$ はイソブチル基を表わし、 $t-Bu$ はターシャリーブチル基を表わし、 $c-Bu$ はシクロブチル基を表わし、 $c-Pen$ はシクロペンチル基を表わし、 $c-Hex$ はシクロヘキシル基を表わし、 Ac はアセチル基を表わし、 Ph はフェニル基を表わす。

表 1-1



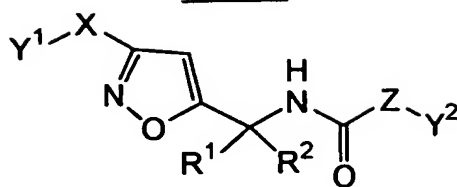
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Z	Y²
I-1	Me-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-2	Et-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-3	n-Pr-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-4	i-Pr-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-5	c-Pr-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-6	c-Hex-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-7	n-Bu-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-8	i-Bu-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-9	t-Bu-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-10	Me₂C=CH-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-11	I-C≡C-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-12	c-Pen-	—	H	H	O	C₆H₅-
I-13		—	H	H	O	C₆H₅-
I-14		—	H	H	O	C₆H₅-
I-15		—	H	H	O	C₆H₅-
I-16		—	H	H	O	C₆H₅-
I-17		—	H	H	O	C₆H₅-

表 1-2



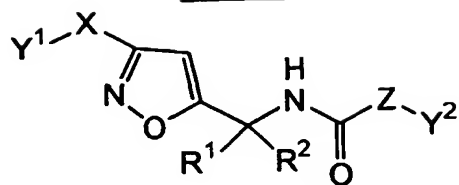
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Z	Y²
I-18		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-19		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-20		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-21		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-22		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-23		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-24	4-Me-3-F-C ₆ H ₃ -	—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-25	4-Me-C ₆ H ₄ -	—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-26	4-MeO-C ₆ H ₄ -	—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-27	4-F-C ₆ H ₄ -	—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-28	2-Cl-C ₆ H ₄ -	—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-29	3-Cl-C ₆ H ₄ -	—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-30	4-Cl-C ₆ H ₄ -	—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-31	2-pyridyl-	—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-32	2-thienyl-	—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-33	2-furyl-	—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-34	4-Me-C ₆ H ₄ -	—	H	H	O	2-MeO-C ₆ H ₄ -

表 1-3



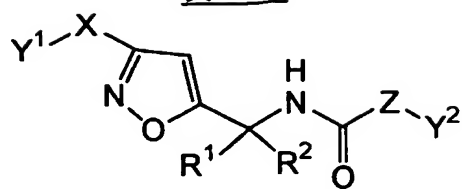
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Z	Y²
I-35	4-Me-C ₆ H ₄ -	—	H	H	O	2-Me-C ₆ H ₄ -
I-36	4-Me-C ₆ H ₄ -	—	H	H	O	2-HOOC-C ₆ H ₄ -
I-37	4-Me-C ₆ H ₄ -	—	H	H	O	2-MeOOC-C ₆ H ₄ -
I-38	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-39	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -CH ₂ -	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-40	C ₆ H ₅ -	-O-CH ₂ -	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-41	C ₆ H ₅ -	—	H	H	-O-CH ₂ -	C ₆ H ₅ -
I-42	C ₆ H ₅ -	—	H	H	-O-CH ₂ -	HC≡C—
I-43	C ₆ H ₅ -	—	H	H	-O-CH ₂ -	I-C≡C—
I-44	C ₆ H ₅ -	—	H	H	-O-CH ₂ -	H ₂ C=CH=CH ₂
I-45	C ₆ H ₅ -	—	H	H		C ₆ H ₅ -
I-46	C ₆ H ₅ -	—	H	H		C ₆ H ₅ -
I-47	i-Pr-	—	H	H		C ₆ H ₅ -
I-48	C ₆ H ₅ -	—	H	H	-CH ₂ -	C ₆ H ₅ -
I-49	C ₆ H ₅ -	—	H	H		C ₆ H ₅ -
I-50	C ₆ H ₅ -	—	H	H		c-Pr-

表 1-4



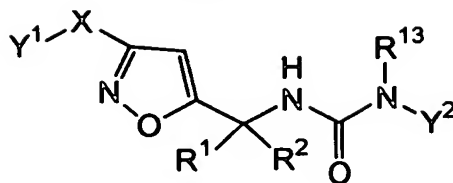
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Z	Y²
I-52	C ₆ H ₅ -		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-53		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-54		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-55		—	H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-56	i-Pr-		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-57	t-Bu-		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-58	c-Pr-		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-59	i-Pr-		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-60	t-Bu-		H	H	O	C ₆ H ₅ -
I-61	c-Pr-		H	H	O	C ₆ H ₅ -

表 1-5



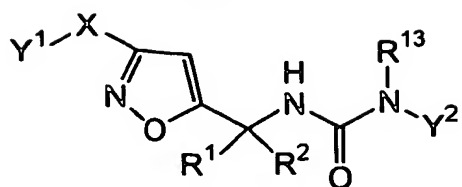
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Z	Y²
I-62	i-Pr-	-	H	H	-CH₂-O-	C₆H₅-
I-63	i-Pr-	-	H	H	-CH₂-	C₆H₅-
I-64	i-Bu-	-	H	H	-CH₂-	C₆H₅-
I-65	ClCH₂-	-	H	H	-CH₂-O-	C₆H₅-
I-66	ClCH₂-	-	H	H	O	C₆H₅-
I-67	ClCH₂-	-	H	H	-CH₂-	C₆H₅-

表 2-1



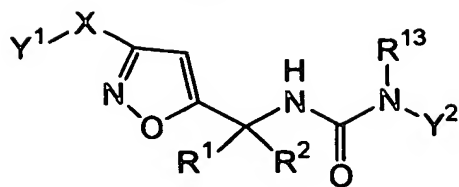
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	R¹³	Y²
II-1	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	H	4-Me-C₆H₄-
II-2	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	H	C₆H₅-
II-3	i-Pr-	—	H	H	H	C₆H₅-
II-4	i-Pr-	—	H	H	Me	C₆H₅-
II-5	C₆H₅-	—	H	H	H	c-Pr-
II-6	C₆H₅-	—	H	H	H	c-Pen-
II-7	C₆H₅-	—	H	H	H	c-Hex-
II-8	4-MeO-C₆H₄-	—	H	H	H	c-Hex-
II-9	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	H	c-Hex-
II-10	4-Me-C₆H₄-	—	H	H	H	c-Pen-
II-11	C₆H₅-	—	H	H	H	
II-12	C₆H₅-	—	H	H	Me	C₆H₆-
II-13	C₆H₅-	-CH₂-	H	H	H	c-Hex-
II-14	C₆H₅-	-CH₂-	H	H	H	c-Pen-
II-15	i-Pr-	—	H	H	H	c-Hex-
II-16	C₆H₅-	—	H	H	H	
II-17	C₆H₅-	—	H	H	H	
II-18	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	H	H	c-Hex-
II-19	4-Me-C₆H₄-	—	Et-	H	H	c-Hex-

表 2-2



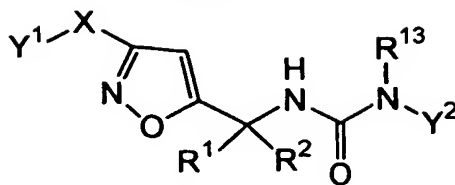
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	R¹³	Y²
II-20	4-Me-C₆H₄-	—	c-Pr-	H	H	c-Hex-
II-21	4-Me-C₆H₄-	—	I-Pr-	H	H	c-Hex-
II-22	4-Me-C₆H₄-	—	MeO-	H	H	c-Hex-
II-23	4-Me-C₆H₄-	—	MeOOC-	H	H	c-Hex-
II-24	4-Me-C₆H₄-	—	NC-	H	H	c-Hex-
II-25	4-Me-C₆H₄-	—	Cl-	H	H	c-Hex-
II-26	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	Me-	H	c-Hex-
II-27	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	MeO-	H	c-Hex-
II-28	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	MeOOC-	H	c-Hex-
II-29	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	NC-	H	c-Hex-
II-30	4-Me-C₆H₄-	—	Me-	Cl-	H	c-Hex-
II-31	C₆H₅-	—	H	H	H	2-Me-C₆H₄-
II-32	C₆H₅-	—	H	H	H	3-Me-C₆H₄-
II-33	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-C₆H₄-
II-34	C₆H₅-	—	H	H	H	4-t-Bu-C₆H₄-
II-35	C₆H₅-	—	H	H	H	2-MeO-C₆H₄-
II-36	C₆H₅-	—	H	H	H	3-MeO-C₆H₄-
II-37	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeO-C₆H₄-
II-38	C₆H₅-	—	H	H	H	4-EtO-C₆H₄-
II-39	C₆H₅-	—	H	H	H	4-t-BuO-C₆H₄-
II-40	C₆H₅-	—	H	H	H	3-t-BuO-C₆H₄-
II-41	C₆H₅-	—	H	H	H	4-i-PrO-C₆H₄-

表 2-3



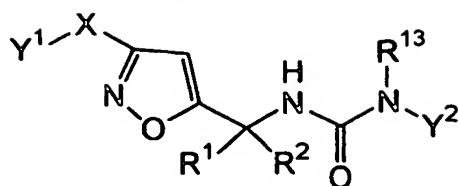
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	R¹³	Y²
II-42	C₆H₅-	—	H	H	H	4-PhO-C₆H₄-
II-43	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeS-C₆H₄-
II-44	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeO₂S-C₆H₄-
II-45	C₆H₅-	—	H	H	H	2-F-C₆H₄-
II-46	C₆H₅-	—	H	H	H	3-F-C₆H₄-
II-47	C₆H₅-	—	H	H	H	4-F-C₆H₄-
II-48	C₆H₅-	—	H	H	H	2-Cl-C₆H₄-
II-49	C₆H₅-	—	H	H	H	3-Cl-C₆H₄-
II-50	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Cl-C₆H₄-
II-51	C₆H₅-	—	H	H	H	2-Br-C₆H₄-
II-52	C₆H₅-	—	H	H	H	3-Br-C₆H₄-
II-53	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Br-C₆H₄-
II-54	C₆H₅-	—	H	H	H	2-CF₃-C₆H₄-
II-55	C₆H₅-	—	H	H	H	3-CF₃-C₆H₄-
II-56	C₆H₅-	—	H	H	H	4-CF₃-C₆H₄-
II-57	C₆H₅-	—	H	H	H	2-NC-C₆H₄-
II-58	C₆H₅-	—	H	H	H	3-NC-C₆H₄-
II-59	C₆H₅-	—	H	H	H	4-NC-C₆H₄-
II-60	C₆H₅-	—	H	H	H	2-HO-C₆H₄-
II-61	C₆H₅-	—	H	H	H	3-HO-C₆H₄-
II-62	C₆H₅-	—	H	H	H	4-HO-C₆H₄-
II-63	C₆H₅-	—	H	H	H	4-NO₂-C₆H₄-

表 2-4



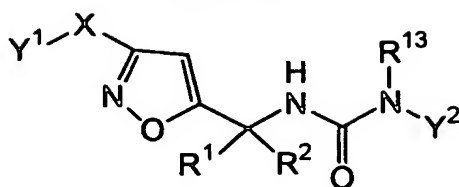
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	R¹³	Y²
II-64	C₆H₅-	—	H	H	H	4-CF₃S-C₆H₄-
II-65	C₆H₅-	—	H	H	H	4-CF₃O-C₆H₄-
II-66	C₆H₅-	—	H	H	H	4-F₂HC-O-C₆H₄-
II-67	C₆H₅-	—	H	H	H	4-HOOC-C₆H₄-
II-68	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeOOC-C₆H₄-
II-69	C₆H₅-	—	H	H	H	3-MeHNOC-C₆H₄-
II-70	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeHNOC-C₆H₄-
II-71	C₆H₅-	—	H	H	H	3-MeOCHN-C₆H₄-
II-72	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeOCHN-C₆H₄-
II-73	C₆H₅-	—	H	H	H	3-H₂N-C₆H₄-
II-74	C₆H₅-	—	H	H	H	4-H₂N-C₆H₄-
II-75	C₆H₅-	—	H	H	H	3-Me₂N-C₆H₄-
II-76	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me₂N-C₆H₄-
II-77	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Ph-C₆H₄-
II-78	C₆H₅-	—	H	H	H	2,5-(Cl)₂-C₆H₃-
II-79	C₆H₅-	—	H	H	H	3,4,(F)₂-C₆H₃-
II-80	C₆H₅-	—	H	H	H	3,4, -(Me)₂-C₆H₃-
II-81	C₆H₅-	—	H	H	H	2,5-(Me)₂-C₆H₃-
II-82	C₆H₅-	—	H	H	H	3,4-(MeO)₂-C₆H₃-
II-83	C₆H₅-	—	H	H	H	3-Cl-4-MeO-C₆H₃-
II-84	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeO-2-HO-C₆H₃-
II-85	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-2-HO-C₆H₃-

表 2-5



化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	R¹³	Y²
II-86	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeO-3-F-C₆H₃-
II-87	C₆H₅-	—	H	H	H	3-F-4-MeO-C₆H₃-
II-88	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-3-F-C₆H₃-
II-89	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-3-Cl-C₆H₃-
II-90	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-3-CF₃-C₆H₃-
II-91	C₆H₅-	—	H	H	H	4-ClCH₂-C₆H₃-
II-92	C₆H₅-	—	H	H	H	4-OHC-C₆H₄-
II-93	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeOOCHNHN-C₆H₄-
II-94	C₆H₅-	—	H	H	H	4-CN-3-F-C₆H₃-
II-95	C₆H₅-	—	H	H	H	4-Me-C₆H₄-
II-96	C₆H₅-	—	H	H	H	4-MeO-C₆H₄-
II-97	C₆H₅-	—	H	H	H	4-CF₃O-C₆H₄-
II-98	C₆H₅-	—	H	H	H	4-t-Bu-C₆H₄-
II-99	C₆H₅-	—	H	H	H	2-pyridyl-
II-100	C₆H₅-	—	H	H	H	3-pyridyl-
II-101	C₆H₅-	—	H	H	H	4-pyridyl-
II-102	C₆H₅-	—	H	H	H	2-thienyl-
II-103	C₆H₅-	—	H	H	H	2-furyl-

表 2-6



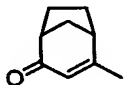
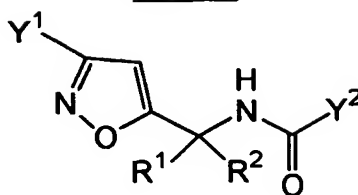
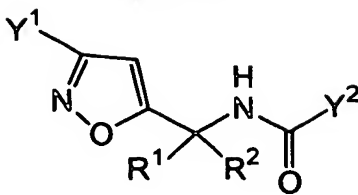
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	R¹³	Y²
II-104	C₆H₅-	-O-CH₂-	H	H	H	c-Hex-
II-105	ClCH₂-	-	H	H	H	c-Hex-
II-106	C₆H₅-	-O-CH₂-	H	H	H	c-Pen-
II-107	ClCH₂-	-	H	H	H	c-Pen-
II-108	Me-	-	H	H	H	c-Hex-
II-109	ClCH₂-	-	H	H	H	C₆H₅-
II-110	Me-	-NHCO-	H	H	H	c-Hex-
II-111	BrCH₂-	-	H	H	H	c-Hex-
II-112		-O-CH₂-	H	H	H	c-Hex-
II-113	NC-CH₂-	-	H	H	H	c-Hex-
II-114	MeS-CH₂-	-	H	H	H	c-Hex-
II-115	ICH₂-	-	H	H	H	c-Hex-
II-116	ClCH₂-	-	H	H	Me	C₆H₅-
II-117	MeOCH₂-	-	H	H	H	c-Hex-
II-118	CH₃COOCH₂-	-	H	H	H	c-Hex-
II-119	HOCH₂-	-	H	H	H	c-Hex-

表 3-1



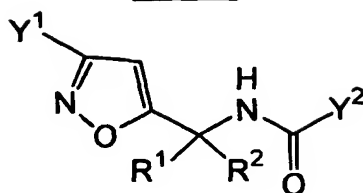
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-1	Me-	H	H	C ₆ H ₅ -
III-2	ClCH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-3	ClCH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-4	i-Pr-	H	H	C ₆ H ₅ -
III-5	i-Pr-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-6	c-Hex-	H	H	C ₆ H ₅ -
III-7	2-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	2-HO-C ₆ H ₄ -
III-8	2-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-9	3-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-10	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-11	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-12	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-13	4-Et-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-14	4-t-Bu-C ₆ H ₄ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-15	2-MeO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-16	3-MeO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-17	4-MeO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-18	4-MeO-C ₆ H ₄ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-19	4-MeO-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-20	4-EtO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-21	4-t-BuO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-22	3-t-BuO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-23	4-i-PrO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-24	4-PhO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -

表 3-2



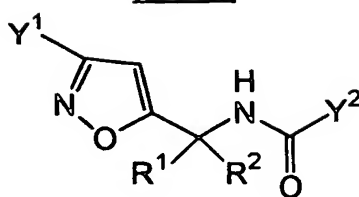
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-25	4-MeS-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-26	4-MeO ₂ S-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-27	4-MeOS-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-28	4-MeS-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-29	2-F-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-30	3-F-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-31	4-F-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-32	2-Cl-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-33	3-Cl-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-34	4-Cl-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-35	2-Br-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-36	3-Br-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-37	4-Br-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-38	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-39	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-40	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-41	2-NC-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-42	3-NC-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-43	4-NC-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-44	2-HO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-45	3-HO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-46	4-HO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-47	4-NO ₂ -C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-48	4-CF ₃ S-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -

表 3-3



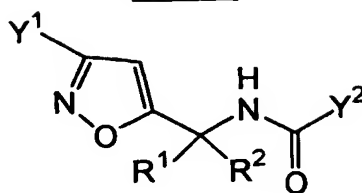
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-49	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-50	4-H ₂ FCO-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-51	4-HOOC-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-52	4-MeOOC-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-53	3-MeHNOC-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-54	4-MeHNOC-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-55	4-MeOHNOC-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-56	3-MeOCHN-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-57	4-MeOCHN-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-58	3-H ₂ N-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-59	4-H ₂ N-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-60	3-Me ₂ N-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-61	4-Me ₂ N-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-62	4-Ph-C ₆ H ₄ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-63	2,5-(Cl) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-64	3,4,(F) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-65	2,4,-(Me) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-66	2,4-(MeO) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-67	3,4-(MeO) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-68	3,4-(MeO) ₂ -C ₆ H ₃ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-69	3-Cl-4-MeO-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-70	4-MeO-2-HO-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-71	4-Me-2-HO-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-72	4-MeO-3-F-C ₆ H ₃ -	H	H	C ₆ H ₅ -

表 3-4



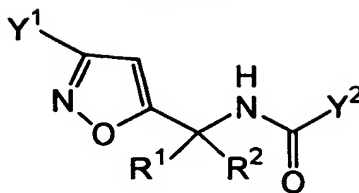
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-73	4-Me-3-F-C₆H₃-	H	H	4-Me-C₆H₄-
III-74	4-MeO-2-F-C₆H₃-	H	H	4-Me-C₆H₄-
III-75	3-F-4-MeO-C₆H₃-	H	H	C₆H₅-
III-76	4-Me-3-F-C₆H₃-	H	H	C₆H₅-
III-77	4-Me-3-Cl-C₆H₃-	H	H	C₆H₅-
III-78	4-Me-3-CF₃-C₆H₃-	H	H	C₆H₅-
III-79	4-ClCH₂-C₆H₄-	H	H	C₆H₅-
III-80	4-OHC-C₆H₄-	H	H	C₆H₅-
III-81	4-MeOOCHNHN-C₆H₄-	H	H	C₆H₅-
III-82	4-CN-3-F-C₆H₃-	H	H	C₆H₅-
III-83	2-pyridyl-	H	H	C₆H₅-
III-84	3-pyridyl-	H	H	C₆H₅-
III-85	4-pyridyl-	H	H	C₆H₅-
III-86	2-thienyl-	H	H	C₆H₅-
III-87	2-furyl-	H	H	C₆H₅-
III-88		H	H	C₆H₅-
III-89		H	H	C₆H₅-
III-90		H	H	C₆H₅-
III-91		H	H	C₆H₅-

表 3-5



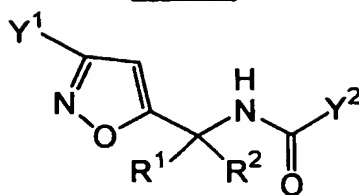
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-92		H	H	C ₆ H ₅ -
III-93		H	H	C ₆ H ₅ -
III-94		H	H	C ₆ H ₅ -
III-95		H	H	C ₆ H ₅ -
III-96		H	H	C ₆ H ₅ -
III-97		H	H	C ₆ H ₅ -
III-98		H	H	C ₆ H ₅ -
III-99		H	H	C ₆ H ₅ -

表 3-6



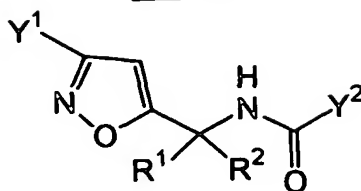
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-100		H	H	C ₆ H ₅ -
III-101		H	H	C ₆ H ₅ -
III-102		H	H	C ₆ H ₅ -
III-103		H	H	C ₆ H ₅ -
III-104		H	H	C ₆ H ₅ -
III-105	C ₆ H ₅ -	H	H	2-Me-C ₆ H ₄ -
III-106	C ₆ H ₅ -	H	H	3-Me-C ₆ H ₄ -
III-107	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-108	C ₆ H ₅ -	H	H	4-t-Bu-C ₆ H ₄ -
III-109	C ₆ H ₅ -	H	H	2-MeO-C ₆ H ₄ -
III-110	C ₆ H ₅ -	H	H	3-MeO-C ₆ H ₄ -
III-111	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-112	C ₆ H ₅ -	H	H	4-EtO-C ₆ H ₄ -

表 3-7



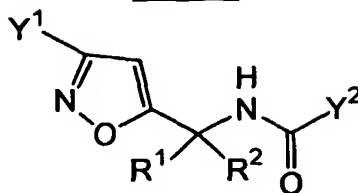
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-113	C ₆ H ₅ -	H	H	4-t-BuO-C ₆ H ₄ -
III-114	C ₆ H ₅ -	H	H	3-t-BuO-C ₆ H ₄ -
III-115	C ₆ H ₅ -	H	H	4-i-PrO-C ₆ H ₄ -
III-116	C ₆ H ₅ -	H	H	4-PhO-C ₆ H ₄ -
III-117	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeS-C ₆ H ₄ -
III-118	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeO ₂ S-C ₆ H ₄ -
III-119	C ₆ H ₅ -	H	H	2-F-C ₆ H ₄ -
III-120	C ₆ H ₅ -	H	H	3-F-C ₆ H ₄ -
III-121	C ₆ H ₅ -	H	H	4-F-C ₆ H ₄ -
III-122	C ₆ H ₅ -	H	H	2-Cl-C ₆ H ₄ -
III-123	C ₆ H ₅ -	H	H	3-Cl-C ₆ H ₄ -
III-124	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄ -
III-125	C ₆ H ₅ -	H	H	2-Br-C ₆ H ₄ -
III-126	C ₆ H ₅ -	H	H	3-Br-C ₆ H ₄ -
III-127	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Br-C ₆ H ₄ -
III-128	C ₆ H ₅ -	H	H	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ -
III-129	C ₆ H ₅ -	H	H	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ -
III-130	C ₆ H ₅ -	H	H	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ -
III-131	C ₆ H ₅ -	H	H	2-NC-C ₆ H ₄ -
III-132	C ₆ H ₅ -	H	H	3-NC-C ₆ H ₄ -
III-133	C ₆ H ₅ -	H	H	4-NC-C ₆ H ₄ -
III-134	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	2-HO-C ₆ H ₄ -
III-135	C ₆ H ₅ -	H	H	3-HO-C ₆ H ₄ -
III-136	C ₆ H ₅ -	H	H	4-HO-C ₆ H ₄ -

表 3-8



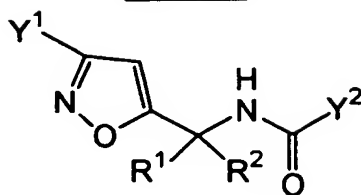
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-137	C ₆ H ₅ -	H	H	4-NO ₂ -C ₆ H ₄ -
III-138	C ₆ H ₅ -	H	H	4-CF ₃ S-C ₆ H ₄ -
III-139	C ₆ H ₅ -	H	H	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ -
III-140	C ₆ H ₅ -	H	H	4-F ₂ HC-O-C ₆ H ₄ -
III-141	C ₆ H ₅ -	H	H	4-HOOC-C ₆ H ₄ -
III-142	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeOOC-C ₆ H ₄ -
III-143	C ₆ H ₅ -	H	H	3-MeHNOC-C ₆ H ₄ -
III-144	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeHNOC-C ₆ H ₄ -
III-145	C ₆ H ₅ -	H	H	3-MeOCHN-C ₆ H ₄ -
III-146	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeOCHN-C ₆ H ₄ -
III-147	C ₆ H ₅ -	H	H	3-H ₂ N-C ₆ H ₄ -
III-148	C ₆ H ₅ -	H	H	4-H ₂ N-C ₆ H ₄ -
III-149	C ₆ H ₅ -	H	H	3-Me ₂ N-C ₆ H ₄ -
III-150	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me ₂ N-C ₆ H ₄ -
III-151	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Ph-C ₆ H ₄ -
III-152	C ₆ H ₅ -	H	H	2,5-(Cl) ₂ -C ₆ H ₃ -
III-153	C ₆ H ₅ -	H	H	3,4,(F) ₂ -C ₆ H ₃ -
III-154	C ₆ H ₅ -	H	H	3,4, -(Me) ₂ -C ₆ H ₃ -
III-155	C ₆ H ₅ -	H	H	2,5-(Me) ₂ -C ₆ H ₃ -
III-156	C ₆ H ₅ -	H	H	3,4-(MeO) ₂ -C ₆ H ₃ -
III-157	C ₆ H ₅ -	H	H	3-Cl-4-MeO-C ₆ H ₃ -
III-158	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeO-2-HO-C ₆ H ₃ -
III-159	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me-2-HO-C ₆ H ₃ -
III-160	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeO-3-F-C ₆ H ₃ -

表 3-9



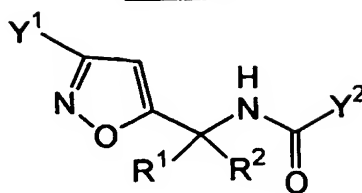
化合物 番号	Y ¹	R ¹	R ²	Y ²
III-161	C ₆ H ₅ -	H	H	3-F-4-MeO-C ₆ H ₃ -
III-162	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	4-Me-3-F-C ₆ H ₃ -
III-163	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me-3-Cl-C ₆ H ₃ -
III-164	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me-3-CF ₃ -C ₆ H ₃ -
III-165	C ₆ H ₅ -	H	H	4-ClCH ₂ -C ₆ H ₄ -
III-166	C ₆ H ₅ -	H	H	4-OHC-C ₆ H ₄ -
III-167	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeOOCHNHN-C ₆ H ₄ -
III-168	C ₆ H ₅ -	H	H	2-HO-3-OHCHN-C ₆ H ₃ -
III-169	C ₆ H ₅ -	H	H	4-CN-3-F-C ₆ H ₃ -
III-170	C ₆ H ₅ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-171	C ₆ H ₅ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-172	C ₆ H ₅ -	H	H	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄ -
III-173	C ₆ H ₅ -	H	H	4-t-Bu-C ₆ H ₄ -
III-174	C ₆ H ₅ -	H	H	2-pyridyl-
III-175	C ₆ H ₅ -	H	H	3-pyridyl-
III-176	C ₆ H ₅ -	H	H	4-pyridyl-
III-177	C ₆ H ₅ -	H	H	2-thienyl-
III-178	C ₆ H ₅ -	H	H	2-furyl-
III-180	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-181	C ₆ H ₅ -	H	H	

表 3-10



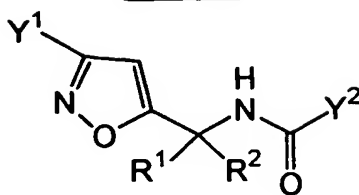
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-182	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-183	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-184	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-185	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-186	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-187	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-188	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-189	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-190	C ₆ H ₅ -	H	H	

表 3-11



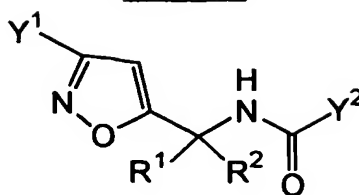
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-191	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-192	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-193	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-194	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-195	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-196	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-197	C ₆ H ₅ -	H	H	

表 3-12



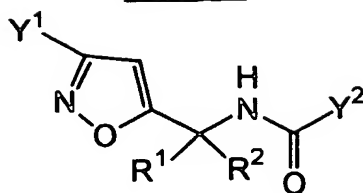
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-198	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-199	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-200	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-201	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-202	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-203	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	
III-204	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	
III-205	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	
III-206	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	

表 3-13



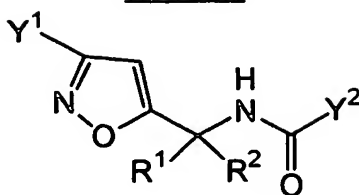
化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-207	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	
III-208	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-209	C ₆ H ₅ -	H	H	Me ₂ C=CH-
III-210		H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-211		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -

表 3-14



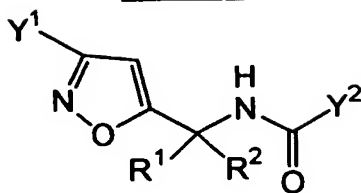
化合物 番号	Y ¹	R ¹	R ²	Y ²
III-212	C ₆ H ₅ -	H	H	
III-213	C ₆ H ₅ -	Me	H	
III-214		H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-215	4-MeO-2-F-C ₆ H ₃ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-216	Me ₂ C=CH-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-217	2-pyridyl-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-218	3-pyridyl-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-219	4-pyridyl-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
III-220	3-thienyl-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-221		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-222	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	c-Hex-
III-223		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-224		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-225	i-Pr-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-226	ClCH ₂ -	H	H	C ₆ H ₅ -
III-227	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	c-Pen-
III-228	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	c-Bu-

表 3-15



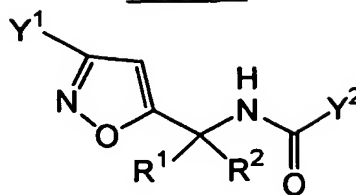
化合物 番号	Y ¹	R ¹	R ²	Y ²
III-229	i-Bu-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-230		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-231	2-Cl-C ₆ H ₄ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-232		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-233	ClCH ₂ -	H	H	c-Hex-
III-234	i-Pr-	H	H	c-Hex-
III-235	n-Bu-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-236		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-237	t-Bu-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-238	c-Hex-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-239		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
III-240	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	
III-241	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	
III-242	4-Me-C ₆ H ₄ -	H	H	

表 3-16



化合物 番号	Y¹	R¹	R²	Y²
III-243	i-Pr-	H	H	
III-244	ClCH₂-	H	H	
III-245	n-Pr-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
III-246		H	H	4-MeO-C₆H₄-
III-247		H	H	4-MeO-C₆H₄-
III-248		H	H	4-MeO-C₆H₄-
III-249		H	H	4-MeO-C₆H₄-
III-250		H	H	4-MeO-C₆H₄-
III-251	i-Bu-	H	H	4-Me-C₆H₄-
III-252	i-Bu-	H	H	4-Cl-C₆H₄-
III-253	i-Bu-	H	H	2,4-Cl₂-C₆H₃-
III-254	ClCH₂-	H	H	4-Cl-C₆H₄-
III-255	i-Bu-	H	H	3,4-Cl₂-C₆H₃-
III-256	i-Bu-	H	H	4-Br-C₆H₄-
III-257	i-Bu-	H	H	4-CF₃-C₆H₄-

表 3-17



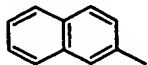
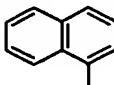
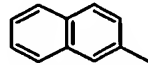
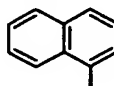
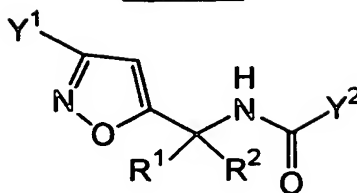
化合物 番号	Y ¹	R ¹	R ²	Y ²
III-258	i-Bu-	H	H	4-Et-C ₆ H ₄ -
III-259	i-Bu-	H	H	
III-260	ClCH ₂ -	H	H	4-Br-C ₆ H ₄ -
III-261	ClCH ₂ -	H	H	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ -
III-262	ClCH ₂ -	H	H	C ₆ H ₅ -CH=CH-
III-263	i-Bu-	H	H	
III-264	n-Pr-	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄ -
III-265	n-Pr-	H	H	4-Br-C ₆ H ₄ -
III-266	n-Pr-	H	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -
III-267	ClCH ₂ -	H	H	
III-268	ClCH ₂ -	H	H	
III-269	ClCH ₂ -	H	H	4-Et-C ₆ H ₄ -
III-270	ClCH ₂ -	H	H	4-ClCH ₂ O-C ₆ H ₄ -
III-271	ClCH ₂ -	H	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -
III-272	ClCH ₂ -	H	H	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -
III-273	ClCH ₂ -	H	H	2-Me-C ₆ H ₄ -
III-274	ClCH ₂ -	H	H	3-Me-C ₆ H ₄ -
III-275	BrCH ₂ -	H	H	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -
III-276	ClCH ₂ -	H	H	2-Cl-C ₆ H ₄ -
III-277	ClCH ₂ -	H	H	3-Cl-C ₆ H ₄ -

表 3-18



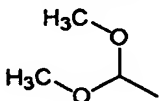
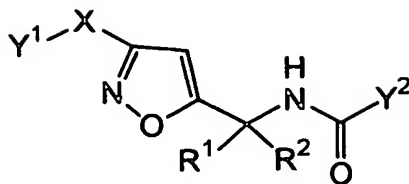
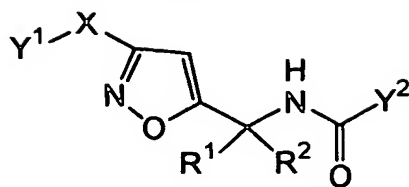
化合物 番号	Y ¹	R ¹	R ²	Y ²
III-278	ClCH ₂ -	H	H	4-NO ₂ -C ₆ H ₄ -
III-279	ClCH ₂ -	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me-C ₆ H ₃ -
III-280	ClCH ₂ -	H	H	2-thienyl-
III-281	ClCH ₂ -	H	H	4-F-C ₆ H ₄ -
III-282	ClCH ₂ -	H	H	4-Ph-C ₆ H ₄ -
III-283	ClCH ₂ -	H	H	4-NC-C ₆ H ₄ -
III-284	HOCH ₂ -	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄ -
III-285		H	H	4-Cl-C ₆ H ₄ -
III-286	ClCH ₂ -	H	H	2-F-C ₆ H ₄ -
III-287	ClCH ₂ -	H	H	3-F-C ₆ H ₄ -
III-288	ClCH ₂ -	H	H	4-I-C ₆ H ₄ -
III-289	ClCH ₂ -	H	H	4-n-Pr-C ₆ H ₄ -
III-290	ClCH ₂ -	H	H	4-SMe-C ₆ H ₄ -
III-291	ClCH ₂ -	H	H	4-SO ₂ Me-C ₆ H ₄ -
III-292	ClCH ₂ -	H	H	2,6-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -
III-293	ClCH ₂ -	H	H	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ -
III-294	ClCH ₂ -	H	H	2,3,4-F ₃ -C ₆ H ₂ -
III-295	ClCH ₂ -	H	H	2,4,5-F ₃ -C ₆ H ₂ -
III-296	ClCH ₂ -	H	H	2-pyridyl-
III-297	ClCH ₂ -	H	H	4-pyridyl-
III-298	FCH ₂ -	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄ -
III-299	ClCH ₂ -	H	H	2,3,6-F ₃ -C ₆ H ₂ -

表 4-1



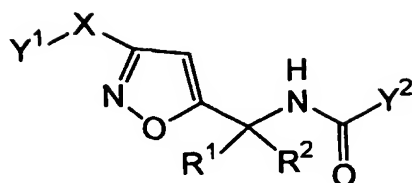
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Y²
IV-1	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	C ₆ H ₅ -
IV-2	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-3	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-4	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	c-Hex-
IV-5	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	c-Hexyloxy-
IV-6	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	4-Et-C ₆ H ₄ -
IV-7	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	2-HO-C ₆ H ₄ -
IV-8	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	4-MeO ₂ S-C ₆ H ₄ -
IV-9	4-MeO-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-10	4-Me-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-11	3-Me-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-12	2-Me-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-13	4-Me-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-14	4-NC-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-15	4-MeOOC-C ₆ H ₄ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-16	3-F-4-MeO-C ₆ H ₃ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-17	4-Me-3-F-C ₆ H ₃ -	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-18	2-pyridyl-	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-19	3-pyridyl-	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-20	4-pyridyl-	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-21	2-thienyl-	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-22	2-furyl-	-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-23	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -	H	H	4-MeOOC-C ₆ H ₄ -

表 4-2



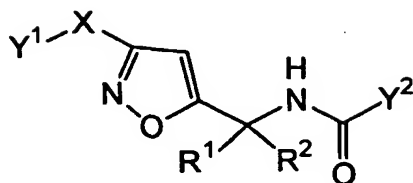
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Y²
IV-24		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-25		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-26		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-27		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-28		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-29	C₆H₅-		H	H	C₆H₅-
IV-30	C₆H₅-		H	H	C₆H₅-
IV-31	C₆H₅-		H	H	C₆H₅-
IV-32	C₆H₅-		H	H	C₆H₅-
IV-33	C₆H₅-	-CH₂-CH₂-	H	H	C₆H₅-
IV-34	C₆H₅-	-CH₂-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-35	C₆H₅-	-CH₂-CH₂-	H	H	4-Me-C₆H₄-

表 4-3



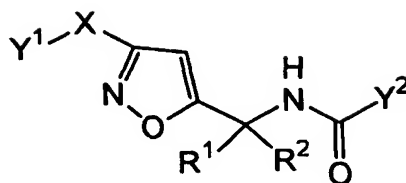
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Y²
IV-36	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-37	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-38	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-39	C ₆ H ₅ -		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-40	C ₆ H ₅ -		H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-41	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-42	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-43	C ₆ H ₅ -		H	H	C ₆ H ₅ -
IV-44	C ₆ H ₅ -	-O-CH ₂ -	H	H	C ₆ H ₅ -
IV-45	C ₆ H ₅ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-46	C ₆ H ₅ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -

表 4-4



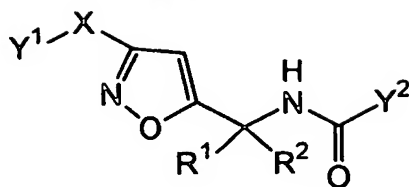
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Y²
IV-47	2-Me-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-48	3-Me-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-49	3-Me-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-50	4-Me-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-51	2-NC-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-52	3-NC-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-53	4-NC-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-54	2-MeO-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-55	3-MeO-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-56	4-MeO-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-57	2-F-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-58	3-F-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-59	4-F-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-60	4-O ₂ N-C ₆ H ₄ -	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-61	c-Hex-	-O-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-62	2-pyridyl-	-O-CH ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-63	C ₆ H ₅ -	-O-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-64	C ₆ H ₅ -	-S-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-65	C ₆ H ₅ -	-SO ₂ -	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-66	C ₆ H ₅ -	-NH-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-67	C ₆ H ₅ -		H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-68	C ₆ H ₅ -	-CH ₂ -O-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -

表 4-5



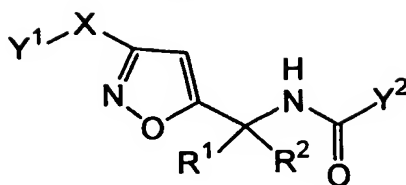
化合物 番号	Y ¹	X	R ¹	R ²	Y ²
IV-69	C ₆ H ₅ -		H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-70	C ₆ H ₅ -	-CO-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-71	C ₆ H ₅ -	-NHCO-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-72		-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-73		-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-74		-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -

表 4-6



化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Y²
IV-75		-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-76	2,6-(MeO)₂-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-77		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-78		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-79		-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-80	2,6-(Me)₂-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-81	4-MeOCHN-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-82	2-MeOOC-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-83	3-MeOOC-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-84	C₆H₅-	-NHCO-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-85	4-MeOOC-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-86	2,6-F₂-C₆H₃-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-87	4-Ac-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-88	4-MeHNOC-C₆H₄-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-89	2-furyl-		H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-90	4-pyridyl-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-

表 4-7



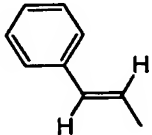
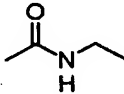
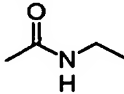
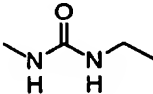
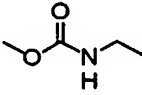
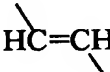
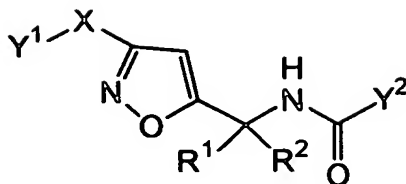
化合物 番号	Y¹	X	R¹	R²	Y²
IV-91	3-pyridyl-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-92	2-pyridyl-	-O-CH₂-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-93	4-F₂HCO-C₆H₄-	-NHCO-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-94	4-MeO-C₆H₄-	-NHCO-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-95	4-F-C₆H₄-	-NHCO-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-96	2-Cl-C₆H₄-	-NHCO-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-97	4-NC-C₆H₄-	-NHCO-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-98	C₆H₅-	-CO-	H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-99	C₆H₅-	-O-CH₂-	H	H	
IV-100	C₆H₅-		H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-101	4-MeO-C₆H₄-		H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-102	C₆H₅-		H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-103	Me-		H	H	4-MeO-C₆H₄-
IV-104	i-Pr-		H	H	4-MeO-C₆H₄-

表 4-8

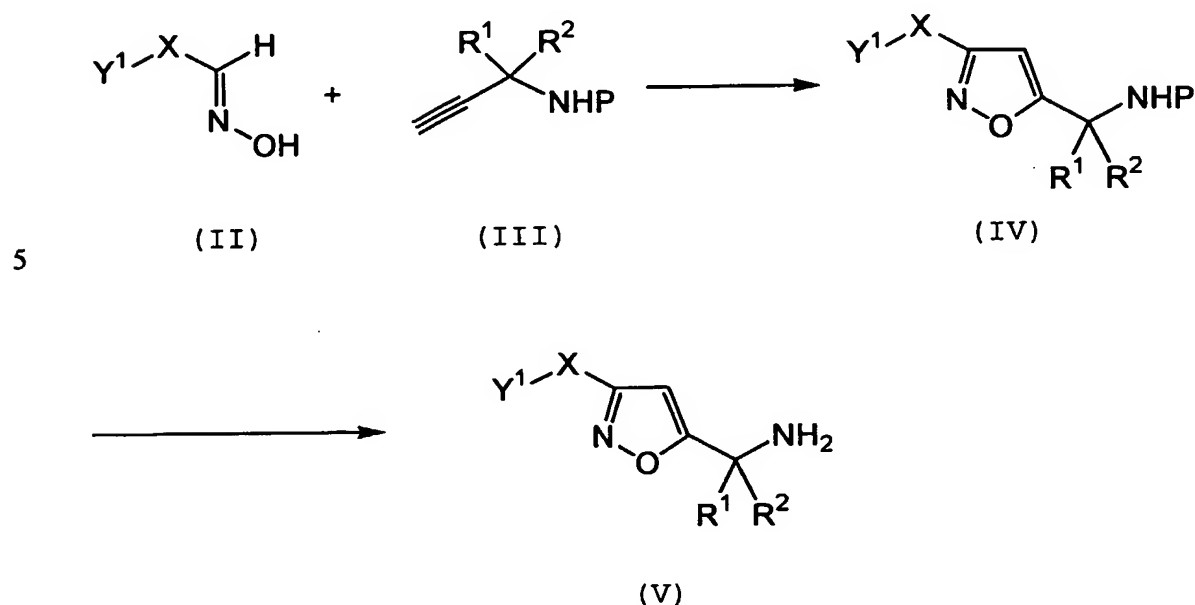


化合物 番号	Y ¹	X	R ¹	R ²	Y ²
IV-105	3-Cl-C ₆ H ₄ -	-NHCO-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-106	4-Cl-C ₆ H ₄ -	-NHCO-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-107	2,4-F ₂ -C ₆ H ₄ -	-NHCO-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-108	4-Me-C ₆ H ₄ -	-NHCO-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-109	C ₆ H ₅ -		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-110	C ₆ H ₅ -	-C≡C-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-111	Me-	-O-CH ₂ -	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-112	2-NC-C ₆ H ₄ -	-NHCO-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-113	C ₆ H ₅ -	-NHCO-	H	H	C ₆ H ₅ -
IV-114	C ₆ H ₅ -	-NHCO-	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄ -
IV-115	C ₆ H ₅ -	-NHCO-	H	H	4-Me-C ₆ H ₄ -
IV-116	C ₆ H ₅ -	-NHCO-	H	H	3-Me-C ₆ H ₄ -
IV-117	C ₆ H ₅ -	-NHCO-	H	H	2-Me-C ₆ H ₄ -
IV-118	i-Pr-	-NHCO-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-119	t-Bu-	-NHCO-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-120	c-Pen-	-NHCO-	H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-121	C ₆ H ₅ -	-O-CH ₂ -	H	H	c-Hex-
IV-122	C ₆ H ₅ -	-O-CH ₂ -	H	H	
IV-123	C ₆ H ₅ -		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -
IV-124	C ₆ H ₅ -		H	H	4-MeO-C ₆ H ₄ -

[本発明化合物の製造方法]

[1] 本発明化合物の製造中間体である置換 5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体 (V) は下記反応工程式 1 に示す方法により製造することができる。

反応工程式 1



(反応工程式中、Pはアミノ基の保護基を表わし、X、Y¹、R¹及びR²は前記と同じ意味を表わす。)

すなわち、一般式 (II) で表されるオキシム誘導体と一般式 (III) で表わされる保護されたプロパルギルアミン誘導体を、適当な溶媒中、ハイポライ
 10 ト類の存在下で反応させて、一般式 (IV) で表わされる置換 5-アルキルア
 ミノイソキサゾール誘導体の保護体を製造することができる。

ここで、アミノ基の保護基としては、t-ブトキシカルボニル基、ベンジ
 ルオキシカルボニル基等が用いられる。

ここで、ハイポライト類としては、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カ

リウム、次亜塩素酸リチウム、次亜臭素酸ナトリウム、次亜臭素酸カリウム等のアルカリ金属類、次亜塩素酸カルシウム、次亜塩素酸マグネシウム、次亜塩素酸ストロンチウム、次亜臭素酸カルシウム、次亜臭素酸マグネシウム等が挙げられる。好ましくは、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カリウム等のアルカリ金属水溶液等である。

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類、及び水、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、N-メチル-2-ピロリドン等、またはこれらの任意の混合溶媒等が好ましく、より好ましくは、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類もしくはこれらから選択される任意の混合溶媒等が挙げられる。

反応温度は通常-80~150℃であり、好ましくは-15~50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から3日間で完結する。

反応中間体である一般式(IV)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えて水洗後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

続いて、一般式(IV)の化合物を適当な溶媒中、適当な脱保護条件にて、一般式(V)で表わされる置換5-アミノアルキルイソキサゾール誘導体を

製造することができる。

- ここで用いられる脱保護条件は保護基によって異なり、例えば α -ブトキシカルボニル基を保護基として使用した場合、塩酸水溶液等のプロトン酸溶液が好ましく、ベンジルオキシカルボニル基を保護基として使用した場合、
- 5 パラジウムカーボン、ラネーニッケル等の触媒存在下、水素気流下で行うのが好ましい。

- 反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、 n -プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒ
- 10 ドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類、及び水、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、 N -メチル-2-ピロリドン等、またはこれらの任意の混合溶媒等が
- 15 好ましい。

反応温度は通常 $-80 \sim 150^{\circ}\text{C}$ であり、好ましくは $-15 \sim 50^{\circ}\text{C}$ である。

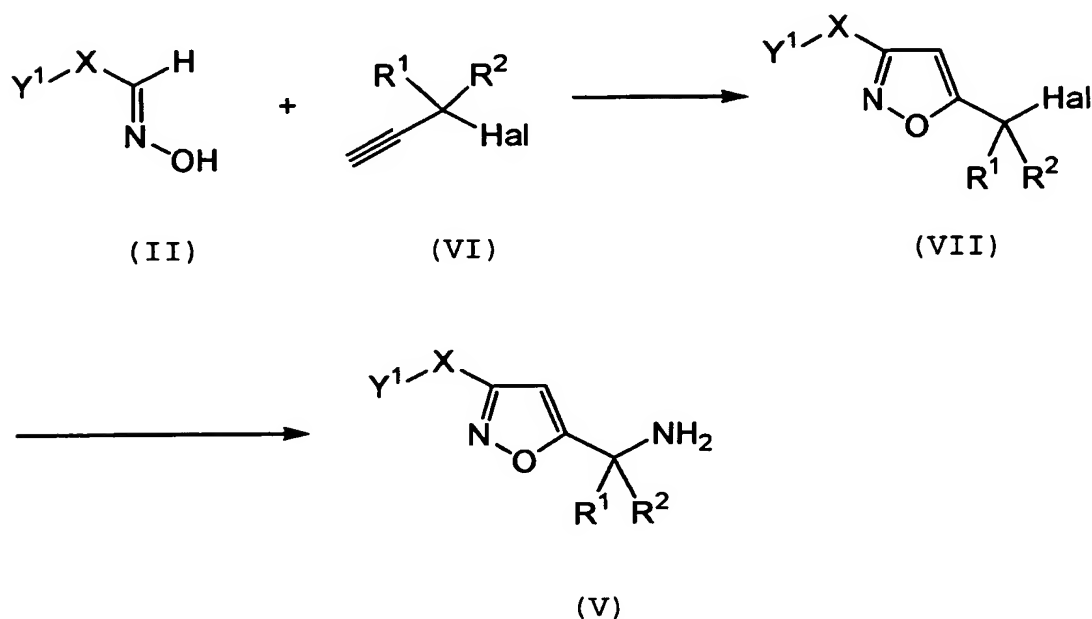
反応時間は、反応温度、反応基質及び反応試薬により異なるが、通常30分から1週間で完結する。

- 20 反応中間体である一般式(V)のアミノアルキルイソキサゾール誘導体は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば α -ブトキシカルボニル基の脱保護条件の場合は、反応混合物の液性をアルカリ性にした後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製する
- 25 こともできる。また、ベンジルオキシカルボニル基の脱保護条件の場合は、

反応触媒を濾過して取り除いた後に、溶媒を留去することにより得られる。
得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

〔2〕 また、一般式（V）の置換5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体
5 は、以下の反応工程式2に示す方法によっても製造できる。

反応工程式 2



（反応工程式中、Halはハロゲン原子を表わし、X、Y¹、R¹及びR²は前記と同じ意味を表わす。）

すなわち、一般式（II）で表わされるオキシム誘導体と一般式（VI）で表わされるプロパルギル誘導体を、適当な溶媒中、ハイポライト類の存在下で
10 反応させて、一般式（VII）で表わされる5-ハロゲノアルキルイソキサゾール誘導体を製造することができる。

ここで、ハイポライト類としては、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カリウム、次亜塩素酸リチウム、次亜臭素酸ナトリウム、次亜臭素酸カリウム

等のアルカリ金属類、次亜塩素酸カルシウム、次亜塩素酸マグネシウム、次亜塩素酸ストロンチウム、次亜臭素酸カルシウム、次亜臭素酸マグネシウム等が挙げられる。好ましくは、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カリウム等のアルカリ金属水溶液等である。

- 5 反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等の
- 10 ハロゲン化炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類、及び水、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、*N*-メチル-2-ピロリドン等、またはこれらの任意の混合溶媒等が好ましく、より好ましくは、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類及びこれらの任意の混合溶媒等を挙げることができる。

- 15 反応温度は通常-80～150℃であり、好ましくは-15～50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から24時間で完結する。

- 20 反応中間体である一般式(VII)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えて水洗後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

- 続いて、一般式(VII)の化合物を適当な溶媒中、アミン類を用いて、一般式(V)で表わされる置換5-アミノアルキルイソキサゾールを製造する
- 25 ことができる。

ここで用いられるアミン類は、ガス状アンモニアもしくはアンモニアージオキサン溶液、アンモニア－エチルアルコール溶液、アンモニア－メチルアルコール溶液、アンモニア－2－プロパノール溶液、アンモニア水溶液が用いられる。

- 5 反応に用いられる溶媒としては反応を阻害しないものであればよく、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n－プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2－ジクロロエタン、1, 10 1, 2－トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられ、好ましくはクロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類が挙げられる。

反応温度は通常－80～150℃であり、好ましくは－15～50℃である。

- 15 反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から1週間で完結する。

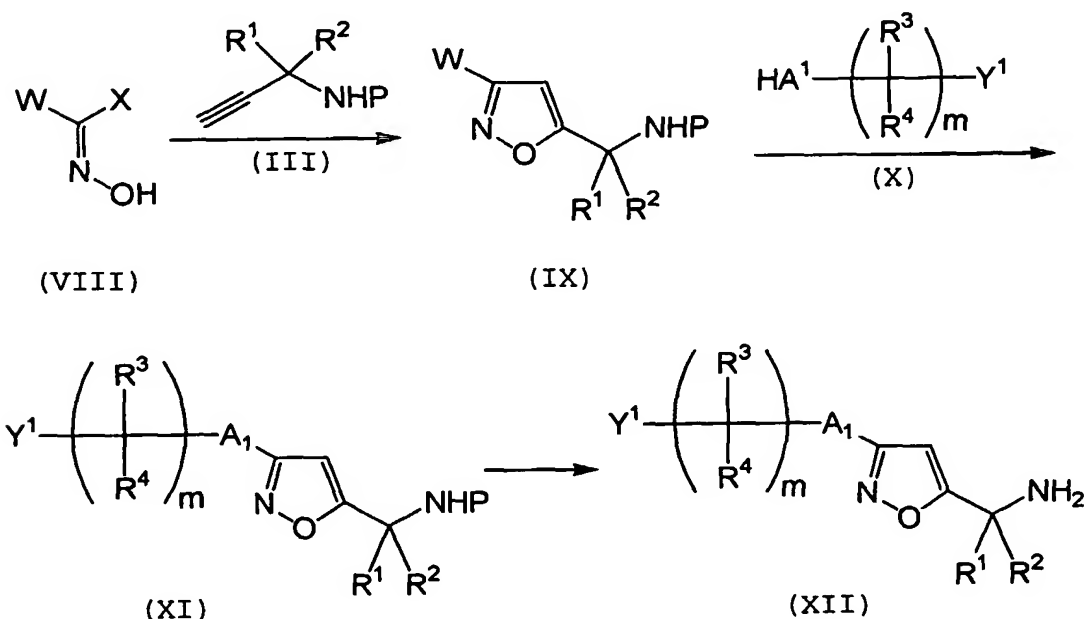
- 反応目的物である一般式(V)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物の液性をアルカリ性にした後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

- 20 なお、前記した一般式(IV)の置換5－アルキルアミノイソキサゾール誘導体は、特開昭52－154525号公報、特表平9－509951号公報、Tetrahedron Letters, Vol.34, No.47, pp7509-7512, 1993、Tetrahedron Letters, 42 25 (2001)1057-1060、Synthetic Communications, 22(13), 1939-1948 (1992)、

Tetrahedron Letters, Vol.27, No.27, pp3181-3182, 1986、Tetrahedron Letters, Vol.33, No.22, pp.3113-3116, 1992 などに記載の方法またはそれらに準じた方法により合成することができる。

- 〔3〕一般式 (XII) で示される置換 5-アルキルイソキサゾール誘導体は、
5 以下の反応工程式 3 に示す方法によって製造することができる。

反応工程式 3



- (反応工程式中、Y¹、R¹、R²、R³、R⁴及びmは、前記と同じ意味を表わし、A¹は、酸素原子、硫黄原子、-NR¹²-基（式中、R¹²は水素原子または低級アルキル基を表わす。）を表わし、H a 1はハロゲン原子を表わし、Pはアミノ基の保護基を表わし、Xはハロゲン原子を表わし、Wはハロゲン原子やトシル基、メシル基等の脱離基を表わす。）
- 10

すなわち、式 (VIII) で示されるハロオキシムと式 (III) で示されるプロパルギルアミン誘導体の保護体とを塩基存在下における 1, 3-双極子付加反応によって式 (IX) で表わされる 3-フェニルスルホニルイソキサゾール

誘導体の保護体を製造することができる。続いて、式 (X) で表わされる求核剤を反応させることによって式 (XI) で表わされる 5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体の保護体を製造することができる。一般式 (XI) で示されるアルキルアミノイソキサゾール誘導体の保護体は、適当な脱保護の条件
5 によって一般式 (XII) で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体を製造することができる。

1, 3-双極子付加反応において使用される塩基としては、例えば、1段階目の反応に用いられる塩基は、この種の反応に一般的に用いられるものが特に制限なく使用できる。例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の
10 アルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ炭酸塩類、更にはトリエチルアミン、トリメチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、1, 5-ジアザビシクロ [4.3.0] ノン-5-エン (DBN)、1, 8-ジアザビシクロ [5.4.0] ウンデセ-7-エン (DBU)
15 等の有機塩基等が挙げられる。

1, 3-双極子付加反応に用いられる溶媒は反応を阻害しないものであればよく、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等の
20 のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられ、好ましくはクロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類が挙げられる。

反応温度は通常 -80 ~ 150℃ であり、好ましくは -15 ~ 50℃ である。
25

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から1週間で完結する。

反応目的物である一般式 (IX) の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、溶媒にて抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

一般式 (X) で示される化合物の一般式 (IX) で示される化合物への求核付加反応に用いられる塩基は、この種の反応に一般的に用いられるものが特に制限なく使用できる。例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ炭酸塩類、更にはトリエチルアミン、トリメチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノン-5-エン (DBN)、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデセ-7-エン (DBU) 等の有機塩基等が挙げられる。

一般式 (X) で示される化合物の一般式 (IX) で示される化合物への求核付加反応に用いられる溶媒は反応を阻害しないものであればよく、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

反応温度は通常-80~150℃であり、好ましくは-15~50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から1週間で完結する。

反応目的物である一般式(XI)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、溶媒にて抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

続いて、一般式(XI)の化合物を適当な溶媒中、適当な脱保護条件にて、一般式(XII)で表わされる置換5-アミノアルキルイソキサゾール誘導体を製造することができる。

ここで用いられる脱保護条件は保護基によって異なり、例えばt-ブトキシカルボニル基を保護基として使用した場合、塩酸水溶液等のプロトン酸溶液が好ましく、ベンジルオキシカルボニル基を保護基として使用した場合、パラジウムカーボン、ラネーニッケル等の触媒存在下、水素気流下で行うのが好ましい。

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1,2-ジクロロエタン、1,1,2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類、及び水、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、N-メチル-2-ピロリドン等、またはこれらの任意の混合溶媒等が好ましい。

反応温度は通常-80~150℃であり、好ましくは-15~50℃である。

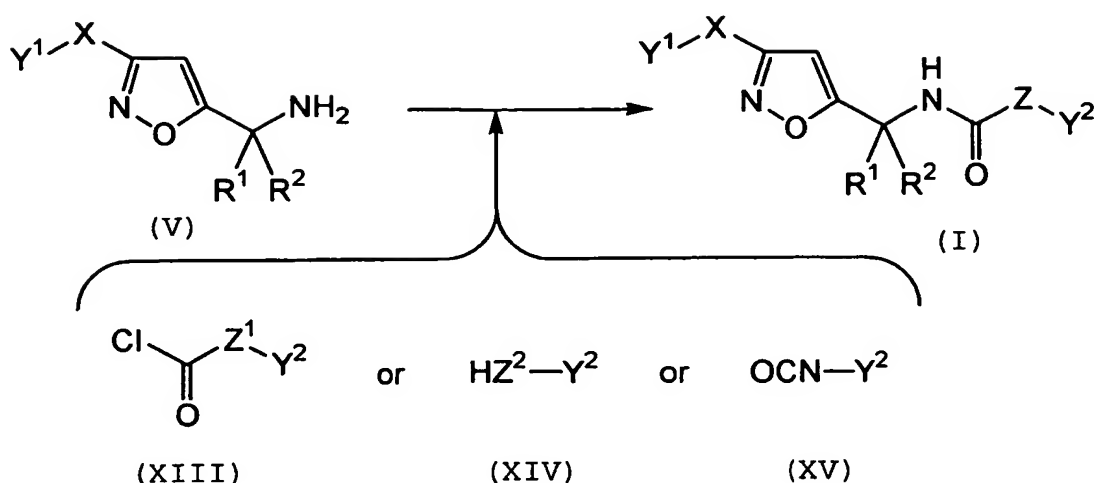
反応時間は、反応温度、反応基質及び反応試薬により異なるが、通常 30 分から 1 週間で完結する。

一般式 (XII) の置換アミノアルキルイソキサゾール誘導体は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば α -ブトキシカルボニル基の
5 脱保護条件の場合は、反応混合物の液性をアルカリ性にした後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。また、ベンジルオキシカルボニル基の脱保護条件の場合は、反応触媒を濾過して取り除いた後に、溶媒を留去することにより得られる。得られた
10 目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

なお、一般式 (VIII) で示されるハロオキシムは、文献既知の化合物であり、例えば、Journal of American Chemical Society, 101, (5), 1319-1320, (1979)、Journal of Organic Chemistry, 1988, 53, 5369-5371、Journal of Organic Chemistry,
15 1983, 46, 1796、Journal of Organic Chemistry, 1984, 49, 4595、Journal of Organic Chemistry, 1987, 52, 2973、特表平 1 1 - 5 0 4 6 5 1 号公報、Synthetic Communications, 22(13), 1939-1948 (1992)、Tetrahedron Letters, Vol.27, No.27, pp3181-3182, 1986、Tetrahedron Letters, Vol.33, No.22, pp3113-3116, (1992)等に、合成方法や関連反応の記載がある。

20 [4] 一般式 (I) で表わされる化合物は、下記の反応工程式 4 に示す方法によって製造できる。

反応工程式 4



(反応工程式中、X、Y¹、Y²、R¹、R²及びZは前記と同じ意味を表わし、Z¹はBがNH基以外のZを示し、Z²はBを含むZである場合を示す。)

- 5 すなわち、置換5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体(V)に、一般式(XIII)で表わされる酸クロライドまたはそれ以外のカルボニル基が活性化された誘導体を、必要であれば適当な塩基の存在下、適当な溶媒中反応させて一般式(I)で表わされる誘導体を製造することができる。

- 10 ここで用いられる一般式(XIII)以外のカルボキシル基が活性化された誘導体としては、例えば一般式(XIII)の酸無水物、一般式(XIII)と他の酸やO-アルキル炭酸等が縮合した混合酸無水物、p-ニトロフェニルエステル、2-テトラヒドロピラニルエステル及び2-ピリジルエステル等の活性化されたエステル類等を挙げることができる。

- 15 ここで塩基としては、この種の反応に一般的に用いられるものが特に制限なく使用できる。例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ炭酸塩類、更にはトリエチルアミン、ト

リメチルアミン、N，N－ジメチルアニリン、ピリジン、N－メチルピペリジン、1，5－ジアザビシクロ〔4.3.0〕ノン－5－エン（DBN）、1，8－ジアザビシクロ〔5.4.0〕ウンデセ－7－エン（DBU）等の有機塩基等が挙げられ、好ましくはトリエチルアミン、ピリジン、N－メチルピペリジンなどの第三級アミン類である。

反応に用いられる溶媒は反応を阻害しないものであればよく、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n－プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1，2－ジクロロエタン、1，1，2－トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

反応温度は通常－80～150℃であり、好ましくは－15～50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から1週間で完結する。

反応目的物である一般式（I）の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えた後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

なお、この反応では、一般式（V）で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体の代わりに一般式（XII）で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体を用いてもよい。

また、一般式（I）の化合物は、一般式（XIV）で示されるアルコール誘導体、チオール誘導体、一級アミノ誘導体、2級アミノ誘導体を適当な溶媒

存在下、適当な縮合剤を必要であれば適当な塩基存在下に反応させ、得られた活性種に対して一般式 (V) の置換 5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体を作用させることで製造することもできる。

ここで用いられる縮合剤としては、N, N'-カルボジリジイミダゾール、
5 4-ニトロフェノキシカルボニルクロライド、ホスゲン、トリホスゲン等が挙げられる。

ここで塩基としては、この種の反応に一般的に用いられるものが特に制限なく使用できる。例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ炭酸塩類、更にはトリエチルアミン、トリメチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノン-5-エン (DBN)、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデセ-7-エン (DBU) 等の有機塩基等が挙げられ、好ましくはトリエチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジンなどの第三級アミン類である。
15

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、
20 四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

反応温度は通常 -80 ~ 150℃であり、好ましくは -15 ~ 50℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常 30 分から 48 時間
25 間で完結する。

反応目的物である一般式（I）の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えた後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

- 5 なお、この反応では、一般式（V）で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体の代わりに一般式（XII）で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体を用いてもよい。

- 10 また、一般式（I）の化合物は、一般式（XV）のイソシアネート誘導体を一般式（V）の置換 5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体反応させることで製造することもできる。

- 15 反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、
四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

反応温度は通常-80～150℃であり、好ましくは-15～50℃である。

- 20 反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から48時間で完結する。

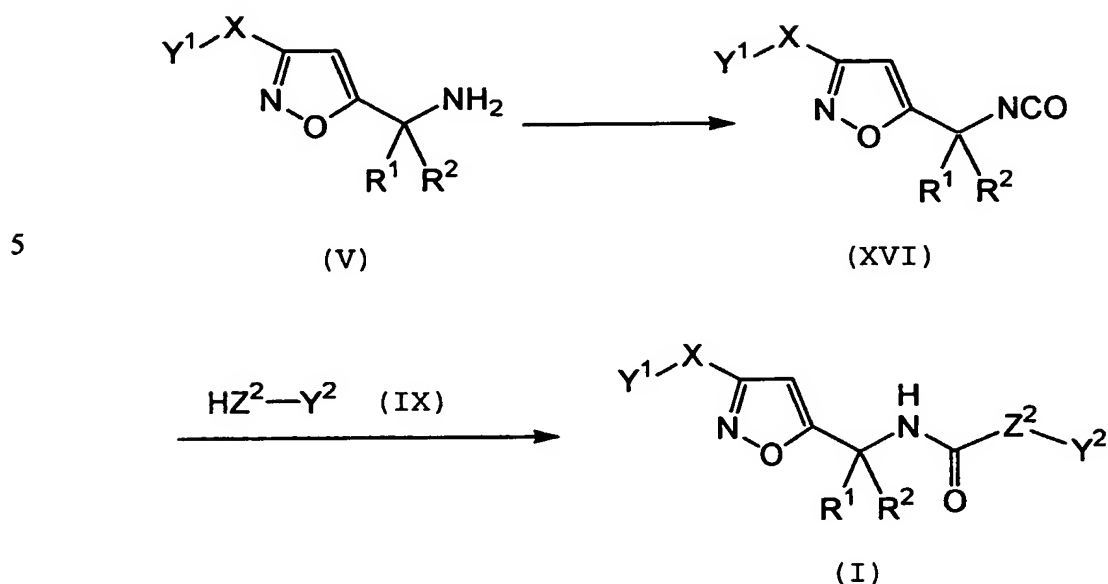
反応目的物である一般式（I）の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えた後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

- 25 なお、この反応では、一般式（V）で示される置換アルキルアミノイソキ

サゾール誘導体の代わりに一般式 (XII) で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体を用いてもよい。

[5] 一般式 (I) で表わされる誘導体は、下記の反応工程式 5 に示す方法によっても製造できる。

反応工程式 5



(反応工程式中、X、Y¹、Y²、R¹、R²及びZ²は、前記と同じ意味を表わす。)

すなわち、置換 5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体 (V) に、ホスゲンもしくはトリホスゲンを用い、必要であれば適当な塩基の存在下、適当な溶媒中反応させて一般式 (XVI) で表わされるイソシアネート誘導体を製造することができる。

ここで塩基としては、この種の反応に一般的に用いられるものが特に制限なく使用できる。例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ炭酸塩類、更にはトリエチルアミン、ト

リメチルアミン、N, N-ジメチルアニリン、ピリジン、N-メチルピペリジン、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノン-5-エン (DBN)、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデセ-7-エン (DBU) 等の有機塩基等が挙げられ、好ましくはトリエチルアミン、ピリジン、N-メチルピペリジンなどの第三級アミン類である。

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、n-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

反応温度は通常-80~150℃であり、好ましくは-15~100℃である。

反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から48時間で完結する。

反応目的物である一般式 (XVI) の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えた後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

なお、この反応では、一般式 (V) で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体の代わりに一般式 (XII) で示される置換アルキルアミノイソキサゾール誘導体を用いてもよい。

続いて、一般式 (I) の化合物は、一般式 (IX) で示されるアルコール誘導体、チオール誘導体、一級アミノ誘導体、2級アミノ誘導体を適当な溶媒存在下、イソシアネート誘導体 (XVI) と反応させることで製造することも

できる。

- 反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、*n*-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、
5 四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、水、またはこれらの任意の混合溶媒等が挙げられる。

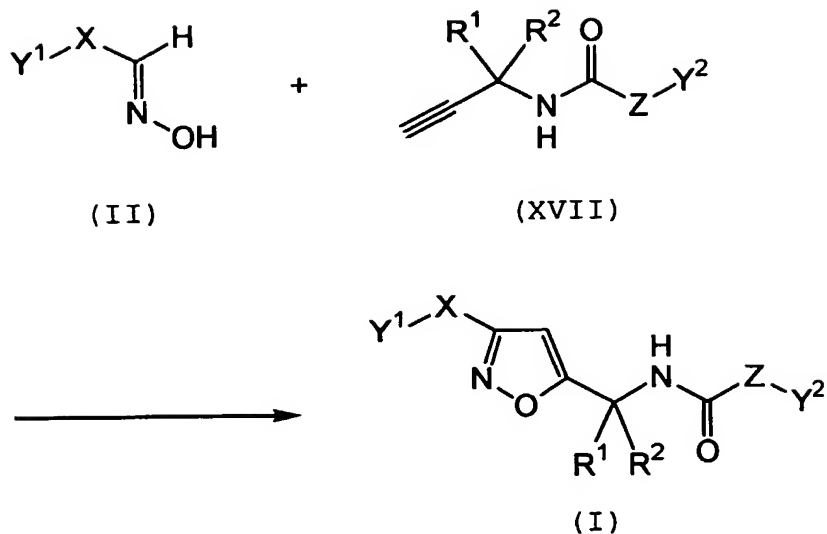
反応温度は通常-80～150℃であり、好ましくは-15～50℃である。

- 10 反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から48時間で完結する。

- 反応目的物である一般式(I)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えた後に、溶媒抽出後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。
15

[6] また一般式(I)で表わされる置換5-アルキルアミノイソキサゾール誘導体は、下記反応工程式6に示す方法でも製造することができる。

反応工程式 6



(反応工程式中、X、Y¹、Y²、R¹、R²、Zは、前記と同じ意味を表わす。)

すなわち、一般式 (II) で表わされるオキシム誘導体と式 (XVII) で表わ
 5 されるプロパルギルアミン誘導体を、適当な溶媒中、ハイポライト類の存在
 下で反応させて、一般式 (I) で表わされる誘導体を製造することができる

ここで、ハイポライト類としては、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カ
 リウム、次亜塩素酸リチウム、次亜臭素酸ナトリウム、次亜臭素酸カリウム
 等のアルカリ金属類、次亜塩素酸カルシウム、次亜塩素酸マグネシウム、次
 10 亜塩素酸ストロンチウム、次亜臭素酸カルシウム、次亜臭素酸マグネシウム
 等が挙げられる。好ましくは、次亜塩素酸ナトリウム、次亜塩素酸カリウム
 等のアルカリ金属水溶液等である。

反応に用いられる溶媒としては、ヘキサン、ペンタン、シクロヘキサン等
 の炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタ
 15 ノール、エタノール、n-プロパノール等の第一級アルコール類、テトラヒ
 ドロフラン、ジオキサン等のエーテル類、クロロホルム、ジクロロメタン、

四塩化炭素、1, 2-ジクロロエタン、1, 1, 2-トリクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸プロピル等のエステル類、及び水、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、N-メチル-2-ピロリドン等、またはこれらの任意の混合溶媒等が
5 好ましく、より好ましくは、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類を挙げることができる。

反応温度は通常-80~150℃であり、好ましくは-15~50℃である。

10 反応時間は、反応温度や反応基質により異なるが、通常30分から24時間で完結する。

一般式(I)の化合物は、反応混合物から通常の後処理により採取される。例えば、反応混合物に水を加えて水洗後、溶媒を留去することにより得られる。得られた目的混合物は、必要ならばカラムクロマトグラフィーや再結晶などの操作によって精製することもできる。

15 なお、化合物(II)のアルドキシム類は、対応するアルデヒド類より、ヒドロキシルアミン塩酸塩と、酢酸ナトリウム等の塩基を用いてエタノール等のアルコール溶媒中で常温もしくは加熱還流条件下で製造することができる。

また、一般式(XVII)のプロパルギルアミン誘導体は、プロパルギルアミンから、クロロギ酸エステル類、イソシアネート類、酸クロライド類等を用
20 いて製造することができる。

[農園芸殺菌剤としての適用]

一般式(I)または(IA)で示される化合物は、有害生物防除作用を有し、農園芸用殺菌剤として使用することができる。

本発明化合物が優れた防除効果を示す植物病害としては、
25 イネいもち病(*Pyricularia oryzae*)、

- イネ紋枯病 (*Rhizoctonia solani*) 、
イネ馬鹿苗病 (*Gibberella fujikuroi*) 、
オオムギうどんこ病 (*Erysiphe graminis* f.sp. *tritici*) 、
コムギうどんこ病 (*Erysiphe graminis* f.sp. *hordei*) 、
5 コムギ眼紋病 (*Pseudocercospora herpotrichoides*) 、
コムギ黒さび病 (*Puccinia graminis*) 、
コムギ炭疽病 (*Colletotrichum graminicola*) 、
コムギ葉枯病 (*Septoria tritici*) 、
コムギ雲形病 (*Phyechosporium secalis* f.sp. *hordei*) 、
10 ジャガイモ疫病 (*Phytophthora infestans*) 、
ジャガイモ夏疫病 (*Alternaria solani*) 、
ジャガイモ炭疽病 (*Colletotrichum atramentarium*) 、
ジャガイモ黒あざ病 (*Thanatephorus cucumeris*) 、
ジャガイモ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
15 アズキうどんこ病 (*Erysiphe pisi*) 、
アズキ褐斑病 (*Cercospora canescens*) 、
アズキ菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
アズキ炭疽病 (*Colletotrichum phaseolorum*) 、
インゲンマメ褐斑病 (*Cercospora canescens*) 、
20 インゲンマメ菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
インゲンマメ炭疽病 (*Colletotrichum lindemuthianum*) 、
インゲンマメ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
ダイズ炭疽病 (*Colletotrichum truncatum*) 、
ダイズ紫斑病 (*Cercospora kikuchii*) 、
25 ダイズさび病 (*Phakopsora pachyrhizi*) 、

- コンニャク炭疽病 (*Gloeosporium conjac*) 、
コンニャク褐斑病 (*Septoria perillae*) 、
チャ炭疽病 (*Colletotrichum theae-sinensis*) 、
ハウレンソウ褐斑病 (*Cercospora beticola*) 、
5 ハウレンソウ炭疽病 (*Colletotrichum spinaciae*) 、
ハウレンソウべと病 (*Peronospora effusa*) 、
キャベツ黒斑病 (*Alternaria brassicae*) 、
キャベツ黒すす病 (*Alternaria brassicicola*) 、
キャベツ菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
10 キャベツ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
コマツナ炭疽病 (*Colletotrichum higginsianum*) 、
ハクサイ菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
ハクサイ黒斑病 (*Alternaria brassicae*、*Alternaria brassicicola*) 、
カボチャ黒斑病 (*Alternaria cucumerina*) 、
15 カボチャ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
カボチャべと病 (*Pseudoperonospora cubensis*) 、
キュウリうどんこ病 (*Sphaerotheca fuliginea*) 、
キュウリ疫病 (*Phytophthora melonis*) 、
キュウリ褐斑病 (*Corynespora cassiicola*) 、
20 キュウリ菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
キュウリ黒斑病 (*Alternaria cucumerina*) 、
キュウリ炭疽病 (*Colletotrichum lagenarium*) 、
キュウリつる割病 (*Fusarium oxysporum* f.sp. *cucumerinum*) 、
キュウリ苗立枯病 (*Pythium cucurbitacearum*、*Rhizoctonia solani*) 、
25 キュウリ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、

- キュウリホモプシス根腐病 (*Phomopsis* sp.) 、
キュウリベと病 (*Pseudoperonospora cubensis*) 、
スイカうどんこ病 (*Sphaerotheca fuliginea*) 、
スイカ疫病 (*Phytophthora cryptogea*) 、
5 スイカ菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
スイカ炭疽病 (*Colletotrichum orbiculare*) 、
スイカベと病 (*Pseudoperonospora cubensis*) 、
メロン褐斑病 (*Corynespora cassicola*) 、
メロン菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
10 メロンつる割病 (*Fusarium oxysporum* f.sp. *melonis*) 、
メロンベと病 (*Pseudoperonospora cubensis*) 、
シュンギク萎凋病 (*Fusarium oxysporum*) 、
シュンギク菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
シュンギクさび病 (*Puccinia cnici-oleracei*) 、
15 シュンギク炭疽病 (*Gloeosporium chrysanthemi*、*Gloeosporium carthami*) 、
ニンジン萎凋病 (*Fusarium oxysporum*) 、
ニンジンうどんこ病 (*Erysiphe heraclei*) 、
ニンジン菌核病 (*Sclerotinia intermedia*、*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
ニンジン黒葉枯病 (*Alternaria dauci*) 、
20 ニンジン黒斑病 (*Alternaria radicina*) 、
トウガラシ・ピーマン萎凋病 (*Fusarium oxysporum*) 、
トウガラシ・ピーマンうどんこ病 (*Oidiopsis sicula*) 、
トウガラシ・ピーマン疫病 (*Phytophthora capsici*) 、
トウガラシ・ピーマン菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
25 トウガラシ・ピーマン炭疽病 (*Colletotrichum gloeosporioides*) 、

- トウガラシ・ピーマン灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
トマト萎凋病 (*Fusarium oxysporum* f.sp. *lycopersici*) 、
トマトうどんこ病 (*Oidiopsis sicula*) 、
トマト疫病 (*Phytophthora infestans*) 、
5 トマト菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
トマト灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
トマト葉かび病 (*Fulvia fulva*) 、
ナス疫病 (*Phytophthora infestans*) 、
ナス褐色斑点病 (*Thanatephorus cucumeris*) 、
10 ナス褐色腐敗病 (*Phytophthora capsici*) 、
ナス菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
ナス褐斑病 (*Alternaria solani*) 、
イチゴ萎黄病 (*Fusarium oxysporum*) 、
イチゴ萎凋病 (*Verticillium dahliae*) 、
15 イチゴうどんこ病 (*Sphaerotheca humuli*) 、
イチゴ疫病 (*Phytophthora nicotianae* var. *parasitica*) 、
イチゴ果実腐敗病 (*Pythium ultimum* var. *ultimum*) 、
イチゴ菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
イチゴ黒斑病 (*Alternaria alternata*) 、
20 イチゴ蛇の目病 (*Mycosphaerella fragariae*) 、
イチゴ炭疽病 (*Colletotrichum acutatum*、*Glomerella cingulata*) 、
イチゴ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
アスパラガス褐斑病 (*Cercospora asparagi*) 、
アスパラガス茎枯病 (*Phomopsis asparagi*) 、
25 アスパラガスさび病 (*Puccinia asparagi-lucidi*) 、

- アスパラガス炭疽病 (*Colletotrichum gloeosporioides*) 、
アスパラガス灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
タマネギ疫病 (*Phytophthora nicotianae*) 、
タマネギ黄斑病 (*Cladosporium allii-cepae*) 、
5 タマネギ乾腐病 (*Fusarium oxysporum* f.sp. *cepae*) 、
タマネギ菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
タマネギ黒点葉枯病 (*Septoria alliacea*) 、
タマネギにせ黒斑病 (*Alternaria porri*) 、
タマネギさび病 (*Puccinia allii*) 、
10 タマネギ小菌核病 (*Puccinia allii*) 、
タマネギ小菌核性腐敗病 (*Botrytis squamosa*) 、
タマネギ白色疫病 (*Phytophthora porri*) 、
タマネギ炭疽病 (*Colletotrichum circinans*) 、
タマネギ黒斑病 (*Alternaria* sp.) 、
15 タマネギ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
タマネギ灰色腐敗病 (*Botrytis allii*) 、
タマネギ葉枯病 (*Pleospora herbarum*) 、
タマネギベと病 (*Peronospora destructor*) 、
ニラさび病 (*Puccinia allii*) 、
20 ニラ白斑葉枯病 (*Botrytis byssoidea*) 、
ネギ疫病 (*Phytophthora nicotianae*) 、
ネギ萎凋病 (*Fusarium oxysporum*) 、
ネギ黒渋病 (*Mycosphaerella allicina*) 、
ネギ黒点葉枯病 (*Septoria alliacea*) 、
25 ネギ黒斑病 (*Alternaria porri*) 、

- ネギ小菌核病 (*Sclerotinia allii*) 、
ネギさび病 (*Puccinia allii*) 、
ネギ小菌核腐敗病 (*Botrytis squamosa*) 、
ネギ白色疫病 (*Phytophthora porri*) 、
5 ネギ炭疽病 (*Colletotrichum circinans*) 、
ネギべと病 (*Peronospora destructor*) 、
マンゴー炭疽病 (*Colletotrichum gloeosporioides*) 、
カキうどんこ病 (*Phyllactinia kakicola*) 、
カキ汚染果病 (*Colletotrichum* ssp.、*Glomerella* sp.) 、
10 カキ角斑病 (*Cercospora kakivora*) 、
カキ角斑落葉病 (*Cercospora kaki*) 、
カキ褐紋病 (*Macrophoma kaki*) 、
カキ黒星病 (*Fusicladium levieri*) 、
カキ黒点病 (*Phomopsis kakivora*) 、
15 カキ黒斑病 (*Pseudocercospora fuliginosa*) 、
カキ縮葉病 (*Physalospora kaki*) 、
カキすす病 (*Aureobasidium pullulans*、*Capnophaeum fuliginodes*、
Cladosporium herbarum、*Microxyphium* sp.、*Scorias communis*、*Tripaspermum juglandis*) 、
20 カキすす点病 (*Zygophiala jamaicensis*) 、
カキ炭疽病 (*Gloeosporium kaki*) 、
カキ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
カキ葉枯病 (*Pestalotia diospyri*) 、
カキ葉炭疽病 (*Glomerella cingulata*) 、
25 カキ円星落葉病 (*Mycosphaerella nawae*) 、

- ウメうどんこ病 (*Podosphaera tridactyla*、*Sphaerotheca pannosa*) 、
ウメ枝枯病 (*Botryosphaeria dothidea*) 、
ウメ菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
ウメ黒星病 (*Cladosporium carpophilum*) 、
5 ウメ白さび病 (*Leucotelium pruni-persicae*) 、
ウメ白紋羽病 (*Rosellinia necatrix*) 、
ウメ心腐病 (*Fusarium lateritium*) 、
ウメせん孔病 (*Pseudocercospora circumscissa*) 、
ウメそうか病 (*Sphaceloma pruni-domesticae*) 、
10 ウメ炭疽病 (*Glomerella cingulata*) 、
ウメ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
ウメ灰星病 (*Monilinia fructicola*、*Monilinia laxa*) 、
ウメ葉炭疽病 (*Glomerella mume*) 、
オウトウ菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
15 オウトウうどんこ病 (*Podosphaera tridactyla*) 、
オウトウ黒かび病 (*Rhizopus nigricans*) 、
オウトウ炭疽病 (*Glomerella cingulata*) 、
オウトウ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
オウトウ灰星病 (*Monilinia fructicola*) 、
20 セイヨウナシうどんこ病 (*Phyllactinia mali*) 、
セイヨウナシ疫病 (*Phytophthora cactorum*、*Phytophthora syringae*) 、
セイヨウナシ黒星病 (*Venturia pirina*) 、
セイヨウナシ炭疽病 (*Colletotrichum gloeosporioides*) 、
ナシ赤星病 (*Gymnosporangium asiaticum*) 、
25 ナシうどんこ病 (*Phyllactinia pyri*) 、

- ナシ疫病 (*Phytophthora cactorum*、*Phytophthora syringae*) 、
ナシ黒星病 (*Venturia nashicola*) 、
ナシ黒斑病 (*Alternaria kikuchiana*) 、
ナシすす点病 (*Leptothyrium pomi*) 、
5 ナシ炭疽病 (*Glomerella cingulata*) 、
ナシ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
ナシ灰星病 (*Monilinia fructigena*) 、
ナシ葉炭疽病 (*Colletotrichum gloeosporioides*) 、
ナシ輪紋病 (*Physalospora piricola*) 、
10 モモ赤かび病 (*Fusarium oxysporum*、*Gibberella zeae*) 、
モモうどんこ病 (*Podosphaera tridactyla*、*Sphaerotheca pannosa*) 、
モモ菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
モモ黒かび病 (*Rhizopus nigricans*) 、
モモ黒星病 (*Cladosporium carpophilum*) 、
15 モモ白さび病 (*Leucotelium pruni-persicae*) 、
モモすすかび病 (*Stenella* sp.) 、
モモせん孔病 (*Pseudocercospora circumscissa*、*Phyllosticta persicae*) 、
モモ炭疽病 (*Gloeosporium laeticolor*) 、
モモ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
20 もオ灰星病 (*Monilinia fructicola*) 、
モモホモブシス腐敗病 (*Phomopsis* sp.) 、
リンゴ赤星病 (*Gymnosporangium yamadae*) 、
リンゴうどんこ病 (*Podosphaera leucotricha*) 、
リンゴ疫病 (*Phytophthora cactorum*、*Phytophthora cambivora*、*Phytophthora*
25 *syringae*) 、

- リンゴ褐斑病 (*Diplocarpon mali*) 、
リンゴ環紋葉枯病 (*Cristulariella moricola*) 、
リンゴ黒星病 (*Venturia inaequalis*) 、
リンゴすす点病 (*Zygophiala jamaicensis*) 、
5 リンゴ炭疽病 (*Glomerella cingulata*) 、
リンゴ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
リンゴ斑点落葉病 (*Alternaria alternata*) 、
ブドウうどんこ病 (*Uncinula necator*) 、
ブドウ枝枯菌核病 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 、
10 ブドウ晩腐病 (*Glomerella cingulata*) 、
ブドウ褐斑病 (*Pseudocercospora vitis*) 、
ブドウ褐斑葉枯病 (*Briosia ampelophaga*) 、
ブドウ黒とう病 (*Elsinoe ampelina*) 、
ブドウ黒腐病 (*Phyllosticta ampellicida*) 、
15 ブドウつる割病 (*Phomopsis viticola*) 、
ブドウべと病 (*Plasmopara viticola*) 、
クリ炭疽病 (*Glomerella cingulata*) 、
クリすす病 (*Capnodium salicinum*) 、
クリ褐斑病 (*Morenoella quercina*) 、
20 クリうどんこ病 (*Microsphaera alphitoides*) 、
クリ葉枯病 (*Monochaetia monochaeta*) 、
カンキツ灰色かび病 (*Botrytis cinerea*) 、
カンキツ褐色腐敗病 (*Phytophthora citrophthora*) 、
カンキツ黒点病 (*Diaporthe citri*) 、
25 カンキツ黄斑病 (*Mycosphaerella citri*、*Mycosphaerella horii*) 、

カンキツそうか病 (*Elsinoe fawcettii*) 、
カンキツそばかす病 (*Mycosphaerella pinodes*) 、
カンキツ炭疽病 (*Colletotrichum gloeosporioides*) 、
カンキツさび果病 (*Colletotrichum gloeosporioides*) 等があげられる。

- 5 本発明による化合物の適用は、植物に噴霧、散布、塗布等して処理するか、
または植物の種子、または植物の周囲の土壌あるいは種子を播種する土壌、
水田、水耕栽培の水を有効成分で処理することにより行うことができる。適
用は植物が病原菌に感染する前または感染後に行うことができる。

- 10 本発明の化合物は、農薬製剤で汎用されている担体、界面活性剤、または
補助剤などを配合し、製剤化して使用することができる。

- 15 製剤の態様としては、懸濁剤、油剤、乳剤、液剤、水溶剤、水和剤、フロ
アブル剤、ペースト剤、粒剤、粉剤、錠剤、顆粒状水和剤、燻煙剤、エアロ
ゾル剤、泡沫剤、マイクロカプセル剤、ジャンボ剤、種子用被覆剤、ULV
(コールドミスト、ウォームミスト) 剤などのような剤型が挙げられる。こ
のような態様は、少なくとも一種の本発明化合物と適当な固体担体、液体担
体、液体ガス状担体等の担体類、及び所望により、有効成分の分散性や、他
の性質の改善のために適当な補助剤（例えば、界面活性剤、展着剤、分散剤、
安定剤）とともに混合する通常の方法によって製造することができる。

- 20 固体の担体の例としては、植物性物質（例えば結晶性セルロース、デンプ
ン、木粉、コルク、コーヒー殻等）、繊維状物質、人工の可塑性粉末、粘土
（例えば、カオリン、ベントナイト、白土、珪藻土、合成含水酸化珪素、フ
バサミクレー、酸性白土等）、タルク及び無機物（バーミキュライト、モン
モリロナイト、軽石、硫黄粉末、リン灰石、雲母、セリサイト、石英粉末、
活性炭、炭酸カルシウム等）、高分子化合物（ポリ塩化ビニル、石油樹脂
25 等）、化学肥料（硫安、磷安、硝安、塩安、塩化カルシウム、尿素等）など

が挙げられる。

液体の担体類及び希釈剤の例としては、水、アルコール類（メタノール、エタノール、イソプロピルアルコール、シクロヘキサノール、アルミアルコール等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等）、エーテル類（エチルセロソルブ、ブチルセロソルブ、ジオキサン等）、芳香族炭化水素（ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルベンゼン、メチルナフタレン等）、脂肪族炭化水素（ケロシン、イソパラフィン、ノルマルパラフィン）、エステル類（酢酸イソプロピル、酢酸ベンジル等）、ニトリル類、アミド類（N，N－ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等）、ハロゲン化炭化水素（クロロベンゼン、トリクロロエチレン等）などが挙げられる。

ガス状担体、すなわち噴射剤としては、例えば炭酸ガス、ブタンガス、フルオロカーボンなどが挙げられる。

界面活性剤の例としては、アルキル硫酸エステル、スルホン酸アルキル、アルキルアリールスルホン酸塩、アルキルアリールエーテル類及びそのポリオキシエチレン化物、ポリエチレングリコールエーテル、多価アルコールエステル類、糖アルコール誘導体などが挙げられる。

その他の製剤用補助剤の例としては、カゼイン、ゼラチン、多糖類（澱粉、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等）、リグニン誘導体、ベントナイト、合成水溶性高分子（ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸等）などの固着剤や分散剤、PAP（酸性リン酸イソプロピル）、BHT（2，6－ジ－tert－ブチル－4－メチルフェノール）、BHA（2－tert－ブチル－4－メトキシフェノール）、植物油、糖蜜、寒天、鉱物油、脂肪酸、脂肪酸エステルなどの安定剤が挙げられる。

一般に、上記製剤は、少なくとも一種の本発明化合物（I）を、0.1～

95重量%、好ましくは1～80重量%含む。これらの製剤は単独でまたは希釈して、植物に噴霧、散布、塗布等して処理するか、または植物の種子、または植物の周囲の土壌あるいは種子を播種する土壌、水田、水耕栽培の水に処理することができる。本発明による化合物を植物に噴霧、散布、塗布する場合、約1～50000 ppm、好ましくは約50～1000 ppmの濃度で使用し、植物の周囲の土壌、あるいは水田の水に処理する場合、約1g～5Kg/ヘクタール、好ましくは約2g～100g/ヘクタールの量で使用し、種子を播種する土壌に処理する場合、通常約0.1g～1kg/m²、好ましくは0.5g～500g/m²の量で使用する。

10 本発明の化合物は、効果の拡大のために、他の農薬成分（殺菌剤、殺細菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、除草剤、植物成長調節剤等）の一種またはそれ以上と組み合わせて製剤化することができる。以下にかかる農薬の例を示すが、組み合わせる農薬の例は、これに限定されるものではない。

組み合わせる殺菌剤の例としては、アシベンゾラルーS-メチル、アゾキシストロビン、イソプロチオラン、イブコナゾール、イプロジオン、イプロバリカルブ、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンアルベシル酸塩、エポキシコナゾール、塩基性塩化銅、オキサジキシル、カスガマイシン、カルプロパミド、キノキシフェン、キャプタン、クレソキシムメチル、クロロタロニル、ジアゾファミド、ジエトフェンカルブ、ジクロシメット、ジクロメジン、ジチアノン、ジネブ、シメコナゾール、ジメチリモール、シプロコナゾール、シモキサニル、シルチオフアム、ストレプトマイシン、スピロキサミン、スルフェン酸、チアベンザゾール、チオフアネートメチル、チウラム、チフルザミド、テクロフタラム、テブコナゾール、トリアジメホン、トリアジン、トリシクラゾール、トリフルミゾール、トリフロキシストロビン、トリホリン、トルクロホスメチル、ノニフェノールスルホン酸銅、パクロブト

- ラゾール、バリダマイシン、ピコキシストロビン、ヒドロキシイソキサゾール、ピラクロストロビン、ピロキロン、ファモキサドン、フェナリモル、フェノキサニル、フェリムゾン、フェンヘキサミド、フサライド、ブラストサイジンS、フラメトピル、フルアジナム、フルキノコナゾール、フルジオキソニル、フルトラニル、プロクロラズ、プロシミドン、プロピコナゾール、プロベナゾール、ベフラゾエート、ベノミル、ペンシクロン、ホセチル、ポリオキシシン、マンゼブ、メタラキシル、メトミノストロビン、メパニピリム、メプロニル、有機銅、有機ニッケル、エディフェンフォス、イプロベンフォスなどが挙げられる。
- 5
- 10 組み合わせる殺細菌剤の例としては、テクロフタラム、オキシリニック酸などが挙げられる。
- 組み合わせる殺虫剤の例としては、アセタミプリド、アセフェート、イソキサチオン、イミダクロプリド、エチオフエンカルブ、エチルチオメトン、エトフェンプロックス、オキサミル、カルタップ、カルボスルファン、クロ
- 15 チアニジン、クロマフェノジド、クロルピリホスメチル、シクロプロトリン、ジノテフラン、ジメチルビンホス、ジメトエート、シフルトリン、ジプロフェジン、シラフルオフエン、スピノサド、スルプロホス、ダイアジノン、チアクロプリド、チアメトキサム、チオジカルブ、チオシクラム、チオメトン、テブフェノジド、ニテンピラム、バミドチオン、ピメトロジン、ピラクロホ
- 20 ス、ピリダフェンチオン、フィプロニル、フォプロニル、ブプロフェジン、フラチオカルブ、フルシトリネート、フルバリネート、プロパホス、ペルメトリン、ベンスルタップ、ベンチアゾール、ベンフラカルブ、マラソン、メタスルホカルブ、モノクロトホス、マラソン、フェノブカルブ、テトラクロルビンフォス、トリクロルフオン、EPN、イプロベンフォス、フェントロ
- 25 チオン、イソプロカルブ、カルバリル、フェントエート、プロポキスル、X

MCなどが挙げられる。

組み合わせる殺虫剤の例としては、エトキサゾール、ケルセン、酸化フェンブタスズ、テブフェンピラド、ハルフェンプロックス、ビフェナゼート、
5 ピリミジフェン、ピリミホスメチル、フェンプロパトリン、フルバリネート、
ホサロン、ミルベメクチン、プロパルギッド、ジクロロボスなどが挙げられ
る。

組み合わせる除草剤の例としてはアイオキシニル、アジムスルフロン、ア
シュラム、アトラジン、アニロホス、アラクロール、イマザモックスアンモ
ニウム塩、イマゾスルフロン、インダノファン、エスプロカルブ、エトキシ
10 スルフロン、エトベンザニド、塩素酸塩、オキサジクロメフォン、カフェン
ストロール、キザロホップエチル、クミルロン、グリホサートアンモニウム
塩、グリホサートイソプロピルアミン塩、グリホサートトリメシウム塩、グ
リホサートナトリウム塩、グリホシネート、クレトジム、クロメプロップ、
シアナジン、シクロスルファムロン、ジクワット、シハラホップブチル、シ
15 ハラホップメチル、ジフルフェニカン、ジメタメトリン、ジメテナミド、シ
メトリン、ジメピペレート、シンメチリン、石灰窒素、セトキシジム、ダイ
ムロン、チフェンスルフロンメチル、テニルクロール、テブラロキシジム、
トリフルラリン、ナプロアニリド、パラコート、ハロスルフロンメチル、ビ
アラホス、ビスピリバックナトリウム塩、ビフェノックス、ピペロホス、ピ
20 ラゾキシフェン、ピラゾスルフロンエチル、ピラゾレート、ピラフルフェン
エチル、ピリデート、ピリブチカルブ、ピリミノバックメチル、フェノキサ
プロップエチル、フェントラザミド、ブタクロール、ブタミホス、フルアジ
ホップ、プレチラクロール、プロメトリン、プロモブチド、ペラルゴン酸、
ベンズルフロンメチル、ベンゾビシクロン、ベンゾフェナップ、ベンタゾン、
25 ベンチオカーブ、ペンディメタリン、ペントキサゾン、ベンフレセート、メ

チルイソシアネート、メトラクロール、メトリブジン、メフェナセット、モ
リネート、リニュロン、レナシル、キノクラミン、シマジン、ジクロベニル、
ジウロン、プロパニル、クロルプロファム、MCPAエチル、MCPAチオ
エチル、MCPAナトリウム塩、MCPB、ベンスリド、2, 4-PAなど
5 が挙げられる。

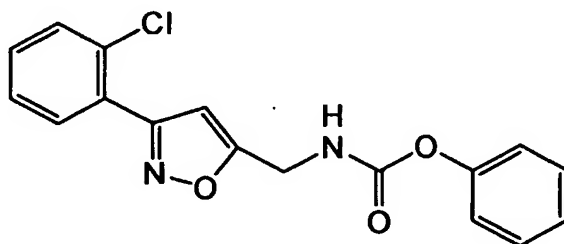
組み合わせる植物成長制御剤としては、イナベンフィド、インドール酢酸、
ウニコナゾール、過酸化カルシウム、ニコチン酸アミド、パクロブトラゾー
ル、プロヘキサジオンカルシウム塩、ベンジルアミノプリンなどが挙げられ
る。

10 発明を実施するための最良の形態

次に、本発明化合物の製造例及び本発明化合物の試験例を挙げて説明する
が、本発明は下記に限定されるものではない。

実施例中、 $^1\text{H-NMR}$ は、内部標準としてテトラメチルシラン、溶媒と
して CDCl_3 を用い、日立社製R-1900型スペクトルメーター（90
15 MHz）にて測定したものを δ 値（ppm）として示した。ただし、 CDCl_3
に難溶な化合物は、 $\text{DMSO}-d_6$ を適量添加して測定を行った。

実施例1：{ [3-（2-クロルフェニル）-5-イソオキサゾリル] メチ
ル} カルバミン酸フェニルの製造（化合物番号I-28）：

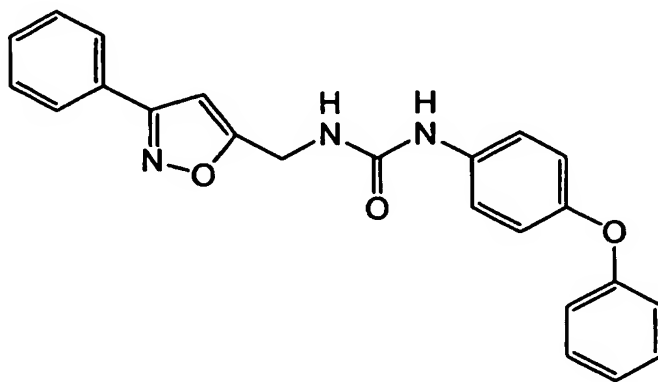


20 5-アミノメチル-3-（2-クロルフェニル）イソオキサゾール0.5

- 1 g とジイソプロピルエチルアミン 0.38 g のジクロロメタン 30 ml の溶液にクロロギ酸フェニル 0.46 g を 0℃ にて加え、室温まで昇温した後 5 時間攪拌した。反応終了後減圧下にて濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、下記物性を有する無色油状の目的物を 0.75 g 得た。

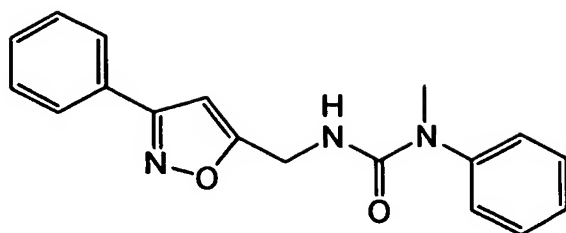
NMR : δ 4.52(2H,d), 5.49-5.88(1H,brs), 6.48(1H,s), 6.99-7.80(9H,m)。

実施例 2 : 3-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-(4-フェノキシフェニル)尿素の製造 (化合物番号 II-42) :



- 5-アミノメチル-3-フェニルイソキサゾール 0.82 g のエタノール 40 ml 溶液に、p-フェノキシフェニルイソシアネート 1.00 g を室温にて加えた後、一晩攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮した後、析出した結晶を濾取し、イソプロピルエーテルにて洗浄し、下記物性を有する無色結晶の目的物を 1.60 g 得た。
- 融点 : 179~181℃。

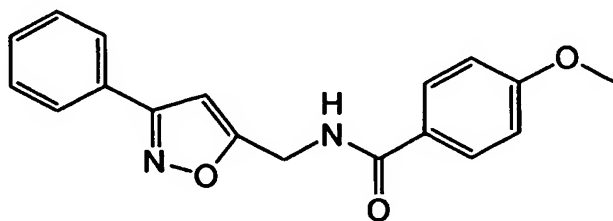
実施例 3 : 3-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-メチル-1-フェニル尿素の製造 (化合物番号 II-12) :



5-アミノメチル-3-フェニルイソオキサゾール 1.00 g とジイソプロピルエチルアミン 0.89 g のジクロロメタン 20 ml の溶液に N-メチル N-フェニルカルバモイルクロライド 0.97 g を 0℃ にて加え、室温まで昇温した後一晩撹拌した。反応終了後減圧下にて濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、下記物性を有する無色結晶の目的物を 1.48 g 得た。

融点：114～117℃。

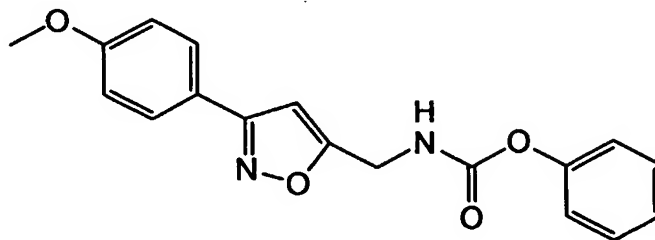
実施例 4：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号 III-111）：



5-アミノメチル-3-フェニルイソオキサゾール 0.60 g とジイソプロピルエチルアミン 0.53 g のジクロロメタン 30 ml 溶液に p-メトキシベンゾイルクロライド 0.59 g を 0℃ にて加え、室温まで昇温した後一晩撹拌した。反応終了後、減圧下にて濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、下記物性を有する無色結晶の目的物を 0.90 g 得た。

融点：182～184℃。

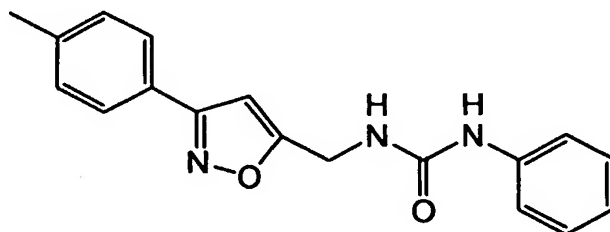
実施例5：{[3-(4-メトキシフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}カルバミン酸フェニルの製造（化合物番号I-26）：



- 5 4-メトキシベンズアルドキシム 2.00 g 及び 2-プロピニルカルバミン酸フェニル 2.78 g のジクロロメタン 50 ml 溶液に 10% 次亜塩素酸ナトリウム水溶液 11.8 g を 0℃ にて 30 分かけて滴下した。室温に昇温した後、5 時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて 2 回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、
- 10 カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色粉末の目的物を 2.25 g 得た。

融点：102～105℃。

実施例6：3-{[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-1-フェニル尿素の製造（化合物番号II-2）：

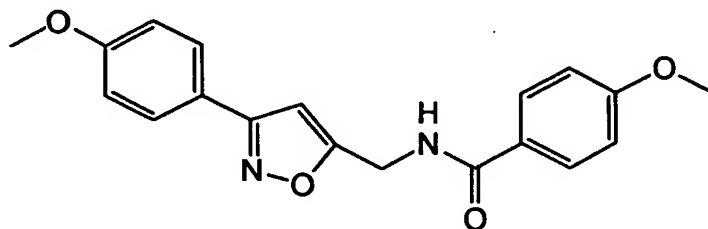


15

4-メチルベンズアルドキシム 4.66 g 及び 3-(2-プロピニル)-
1-フェニル尿素 1.50 g のジクロロメタン 50 ml 溶液に 7.0% 次亜塩
素酸ナトリウム水溶液 36.6 g を 0℃ にて 1 時間かけて滴下した。室温に
昇温した後、7 時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて 2 回抽出し、飽和
5 亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した
後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色粉末の目
的物を 1.87 g 得た。

融点：176～178℃。

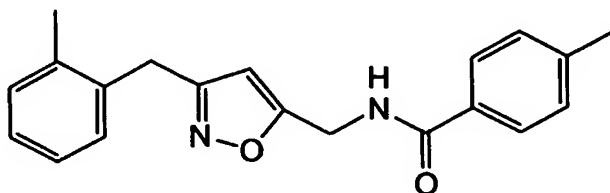
実施例 7：N-{[3-(4-メトキシフェニル)-5-イソオキサゾリ
10 ル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号 III-1
8）：



4-メトキシベンズアルドキシム 4.90 g 及び N-(2-プロピニル)-
1-p-メトキシ安息香酸アミド 1.50 g のジクロロメタン 50 ml 溶
15 液に 6.4% 次亜塩素酸ナトリウム水溶液 37.7 g を 0℃ にて 1 時間かけて
滴下した。室温に昇温した後、一晩攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて 2
回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウ
ムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有す
る無色粉末の目的物を 2.36 g 得た。

20 融点：144～155℃。

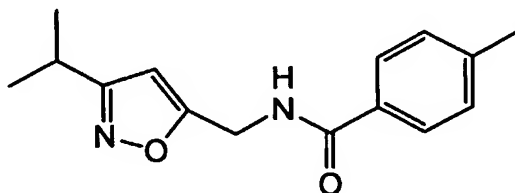
実施例 8 : N- { [3 - (2 - メチルベンジル) - 5 - イソオキサゾリル]
メチル } - 4 - メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV - 1 2) :



2 - メチルベンジルアルドキシム 7.75 g 及び N - (2 - プロピニル)
5 - 1 - p - メチル安息香酸アミド 1.50 g のジクロロメタン 70 ml 溶液
に 4.4 % 次亜塩素酸ナトリウム水溶液 87.9 g を 0℃ にて 30 分かけて滴
下した。室温に昇温した後、2 時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて 2
回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウ
ムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有す
10 る無色油状の目的物を 2.12 g 得た。

NMR : δ 2.27(3H,s), 2.36(3H,s), 3.93(2H,s), 4.62(2H,d), 5.83(1H,s), 6.48-
6.78(1H,brs), 7.13(4H,s), 7.20(2H,d), 7.67(2H,d)。

実施例 9 : N - [(3 - イソプロピル - 5 - イソオキサゾリル) メチル] -
4 - メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III - 5) :



15

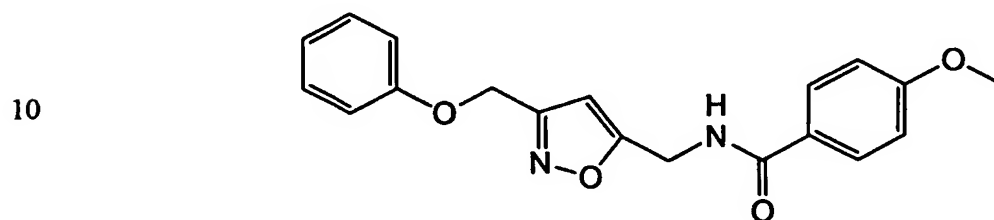
イソプロピルアルドキシム 7.54 g 及び N - (2 - プロピニル) - 1 -
p - メチル安息香酸アミド 1.50 g のジクロロメタン 100 ml 溶液に 4.
0 % 次亜塩素酸ナトリウム水溶液 161.2 g を 0℃ にて 30 分かけて滴下

した。室温に昇温した後、1晩攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて2回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色油状の目的物を0.56g得た。

5 融点：107～116℃；

NMR： δ 1.25(6H,d), 2.38(3H,s), 2.78-3.24(1H,m), 4.69(2H,d), 6.08(1H,s), 6.85(1H,br), 7.21(2H,d), 7.71(2H,d)。

実施例10：N-〔(3-フェニルオキシメチルー5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-45)：

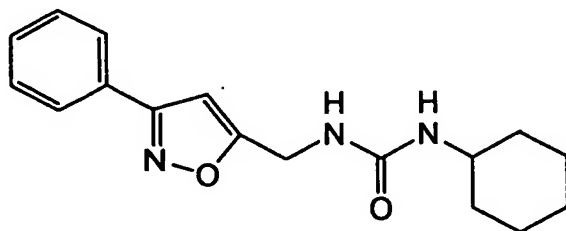


フェニルオキシメチルアルドキシム5.99g及びN-(2-プロピニル)-1-p-メトキシ安息香酸アミド1.50gのジクロロメタン50ml溶液に4.5%次亜塩素酸ナトリウム水溶液65.6gを0℃にて30分かけて滴下した。室温に昇温した後、1晩した。水を加え、酢酸エチルにて2

15 回抽出し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色ペーストの目的物を1.00g得た。

NMR： δ 3.82(3H,s), 4.72(2H,d), 5.12(2H,s), 6.34(1H,s), 6.41-6.65(1H,brs), 6.75-7.88(9H,m)。

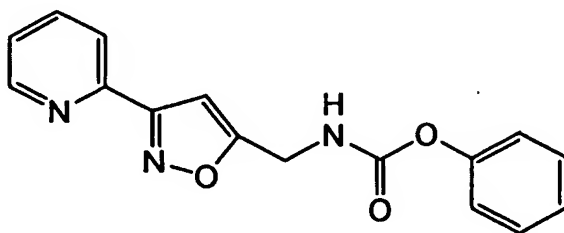
実施例 11 : 3-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II-7) :



5 5-アミノメチル-3-フェニルイソキサゾール 1.00 g のエタノール 30 ml 溶液に、シクロヘキシルイソシアネート 0.79 g を室温にて加えた後、一晩攪拌した。反応溶液を減圧下濃縮した後、析出した結晶を濾取し、イソプロピルエーテルにて洗浄し、下記物性を有する無色結晶の目的物を 1.65 g 得た。

融点 : 155 ~ 158 °C。

10 実施例 12 : { [3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル]メチル } カルバミン酸フェニルの製造 (化合物番号 I-31) :



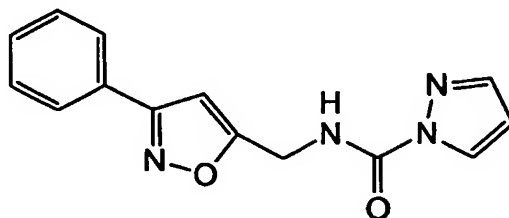
15 5-アミノメチル-3-(2-ピリジル)イソオキサゾール 1.00 g とジイソプロピルエチルアミン 0.89 g のジクロロメタン 30 ml の溶液にクロロギ酸フェニル 0.89 g を 0 °C にて加え、室温まで昇温した後 1 時間攪拌した。反応終了後減圧下にて濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、下記物性を有する無色結晶の目的物を 1.62 g 得

た。

融点：104～107℃。

実施例13：N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-ピラゾリルアミドの製造(化合物番号III-192)：

5



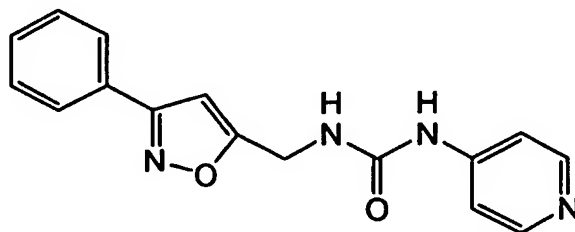
10

ピラゾール0.78gのテトラヒドロフラン30ml溶液にN,N'-カルボジリジイミダゾール0.93gを室温にて加え、1時間攪拌した。続いて、反応溶液に5-アミノメチル-3-フェニルイソオキサゾール1.00gを加えて一晩攪拌した。反応終了後、減圧下にて濃縮した後、シリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製して、下記物性を有する無色結晶の目的物を1.51g得た。

融点：137～138℃。

実施例14：3-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-(4-ピリジル)尿素の製造(化合物番号II-101)：

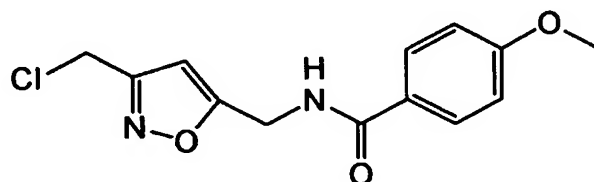
15



4-アミノピリジン0.65gのテトラヒドロフラン30ml溶液にN,

- N'-カルボジルジイミダゾール 0.93 g を室温にて加え、一晚攪拌した。
 続いて反応溶液に 5-アミノメチル-3-フェニルイソオキサゾール 1.0
 g を加えて一晚攪拌した。反応終了後、減圧下にて濃縮した後、シリカゲル
 カラムクロマトグラフィーにて精製して、下記物性を有する無色結晶の目的
 5 物を 1.62 g 得た。
 融点：156～162℃。

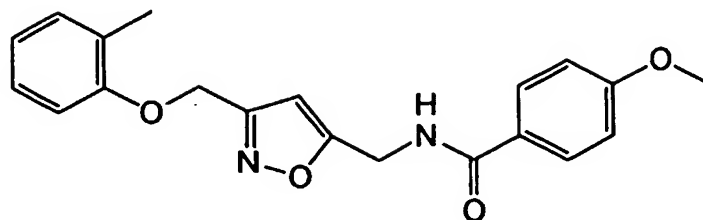
実施例 15：N-〔(3-クロルメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-
 -4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号 III-3）：



- 10 クロルメチルアルドキシム 47.7 g 及び N-(2-プロピニル)-1-
 p-メトキシ安息香酸アミド 6.43 g のジクロロメタン 150 ml 溶液に
 10%次亜塩素酸ナトリウム水溶液 380 g を 0℃にて1時間かけて滴下し
 た。室温に昇温した後、一晚攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて2回抽出
 し、飽和亜硫酸ナトリウム水溶液にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて
 15 乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色
 固体の目的物を 5.83 g 得た。
 融点：93～110℃；
 NMR： δ 3.86(3H,s), 4.53(2H,s), 4.72(2H,d), 6.31(1H,s), 6.69(1H,brs),
 6.92(2H,d), 7.75(2H,d)。

- 20 実施例 16：N-〔[3-(2-メチルフェニル)オキシメチル-5-イソ

オキサゾリル] メチル} - 4 - メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-47) :



- 5 N-[(3-クロルメチル-5-イソオキサゾリル) メチル] - 4 - メトキシ安息香酸アミド 1.20 g 及び 2-メチルフェノール 1.85 g のジメチルホルムアミド 30 ml 溶液に炭酸カリウム 0.89 g を室温にて加えた。100℃に昇温し、5時間攪拌した。水を加え、酢酸エチルにて2回抽出し、集めた有機層を水及び飽和食塩水にて洗浄した。無水硫酸マグネシウムにて乾燥した後、カラムクロマトグラフィーにて精製し、下記物性を有する無色
- 10 固体の目的物を 0.65 g 得た。

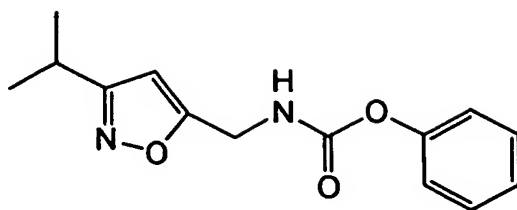
融点 : 115 ~ 117℃ ;

NMR : δ 2.20(3H,s), 3.80(3H,s), 4.68(2H,d), 5.08(2H,s), 6.30(1H,s), 6.61-7.82(9H,m)。

実施例 17

- 15 実施例 1 ~ 16 に記載の方法により、以下に示す実施例 17 (1) ~ 17 (115) に示す化合物を得た。

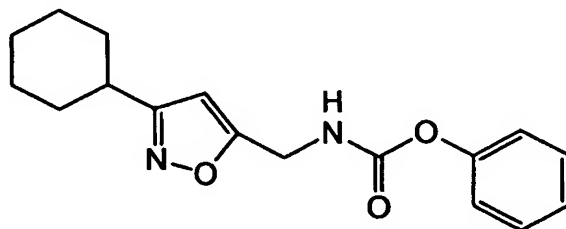
実施例 17 (1) : [(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル) メチル] カルバミン酸フェニルの製造 (化合物番号 I-4) :



性状：油状,

NMR : δ 1.28(6H, d), 2.75-3.29(1H, m), 4.52(2H, d), 5.34-5.72(1H, brs), 6.12(1H, s), 7.00-7.48(5H, m)。

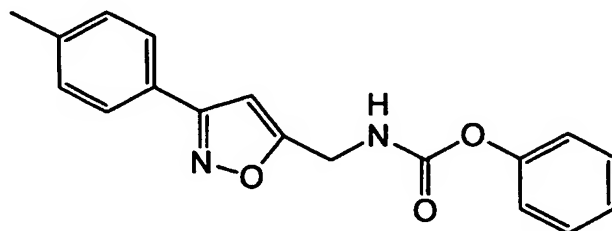
- 5 実施例 17 (2) : [(3-シクロヘキシル-5-イソオキサゾリル) メチル] カルバミン酸フェニルの製造 (化合物番号 I-6) :



性状：ペースト,

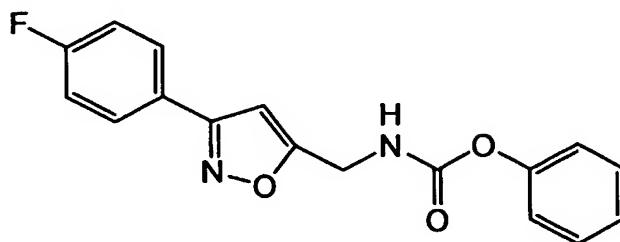
- 10 NMR : δ 1.08-2.10(10H, m), 2.48-2.91(1H, brs), 4.42(2H, d), 5.80-6.00(1H, brs), 6.02(1H, s), 6.98-7.48(5H, m)。

- 実施例 17 (3) : { [3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル] メチル } カルバミン酸フェニルの製造 (化合物番号 I-25) :



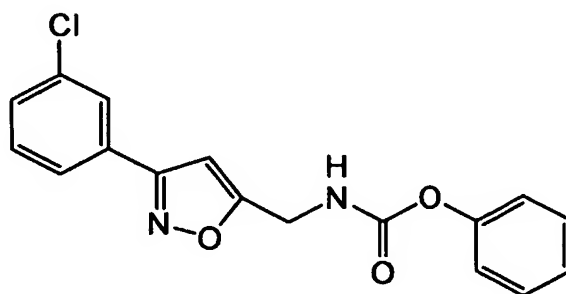
融点：119～123℃。

実施例17(4)：{[3-(4-フルオロフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}カルバミン酸フェニルの製造(化合物番号I-27)：



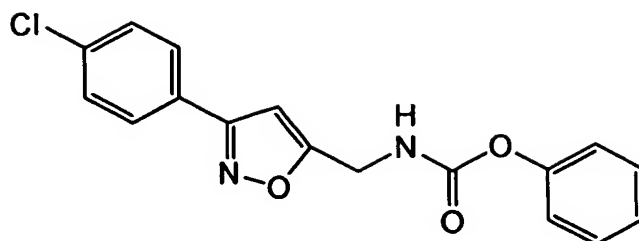
5 融点：114～116℃。

実施例17(5)：{[3-(3-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}カルバミン酸フェニルの製造(化合物番号I-29)：



融点：103～105℃。

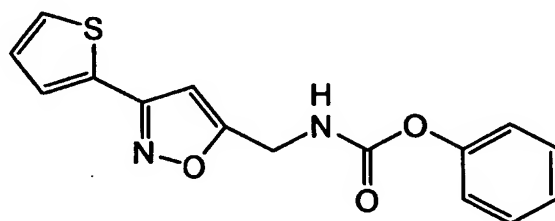
10 実施例17(6)：{[3-(4-クロロフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}カルバミン酸フェニルの製造(化合物番号I-30)：



融点：135～137℃。

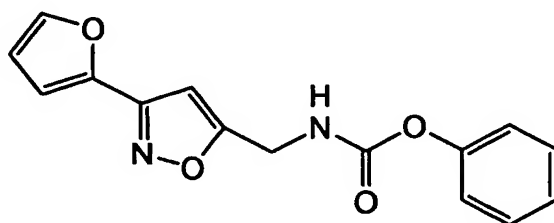
実施例17(7)：{[3-(2-チエニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}カルバミン酸フェニルの製造(化合物番号I-32)：

5



融点：104～107℃。

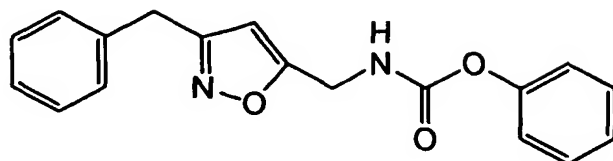
実施例17(8)：{[3-(2-フリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}カルバミン酸フェニルの製造(化合物番号I-33)：



10 融点：89～92℃。

実施例17(9)：[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]カ

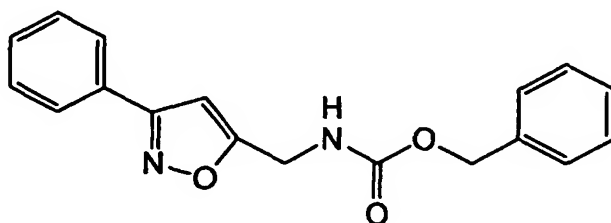
ルバミン酸フェニルの製造（化合物番号 I-38）：



融点：135～137℃。

実施例 17（10）：〔（3-フェニル-5-イソオキサゾリル）メチル〕

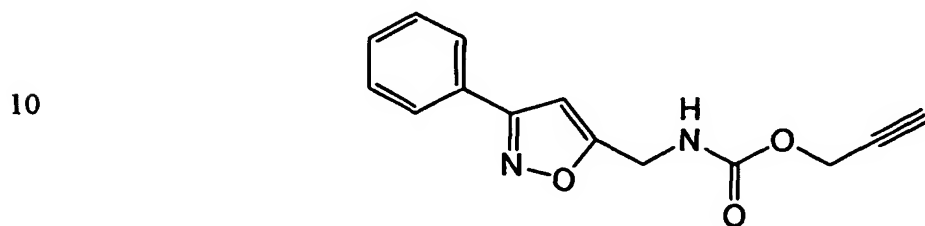
5 カルバミン酸ベンジルの製造（化合物番号 I-41）：



融点：104～105℃。

実施例 17（11）：〔（3-フェニル-5-イソオキサゾリル）メチル〕

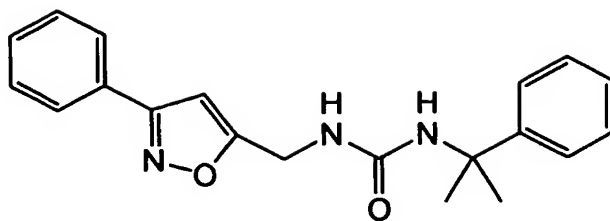
カルバミン酸 2-プロピニルの製造（化合物番号 I-42）：



融点：102～104℃。

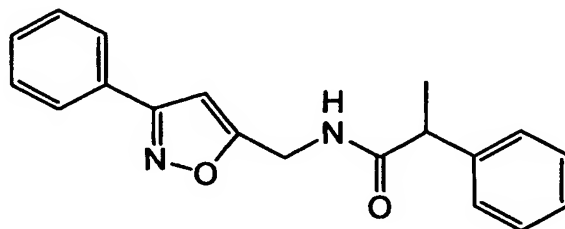
実施例 17（12）：3-〔（3-フェニル-5-イソオキサゾリル）メチル〕-1-（1-メチル-1-フェニルエチル）尿素の製造（化合物番号 I

－ 4 5) :



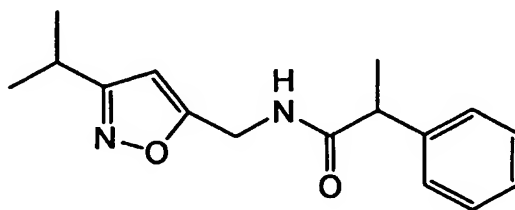
融点 : 160 ~ 164℃。

実施例 17 (13) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]
5 ル] 2-フェニルプロパン酸アミドの製造 (化合物番号 I-46) :



融点 : 110 ~ 112℃。

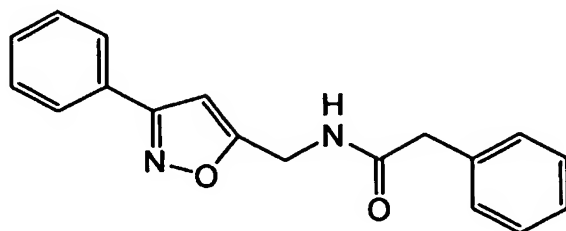
実施例 17 (14) : N-[(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル)
メチル] - 2-フェニルプロパン酸アミドの製造 (化合物番号 I-47) :



性状 : 油状,

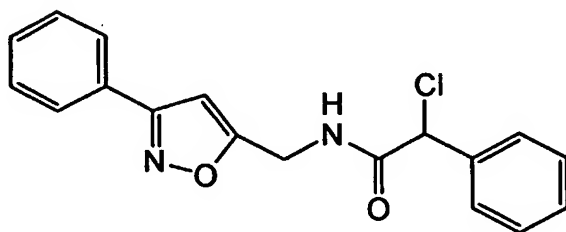
NMR : δ 0.80-1.66(9H, m), 2.67-3.14(1H, m), 3.27-3.81(1H, m), 4.40(2H, d),
5.80(1H, s), 6.22-6.51(1H, br), 7.26(5H, s)。

実施例 17 (15) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル] 2-フェニルエタン酸アミドの製造 (化合物番号 I-48) :



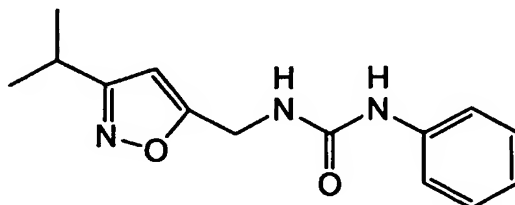
融点 : 153 ~ 154 °C。

- 5 実施例 17 (16) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル] 2-クロル-2-フェニルエタン酸アミドの製造 (化合物番号 I-49) :



融点 : 121 ~ 125 °C。

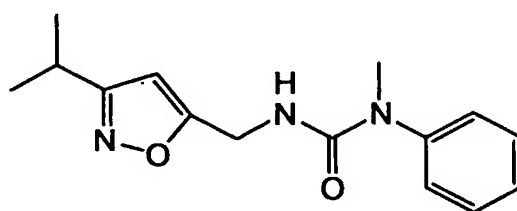
- 10 実施例 17 (17) : 1-[(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-フェニル尿素の製造 (化合物番号 II-3) :



性状：ペースト，

NMR : δ 1.08(6H, d), 2.69-3.14(1H, m), 4.33(2H, d), 5.98(1H, s), 6.22-6.44(1H, brs), 6.86-7.31(5H, m), 7.92(1H, d)。

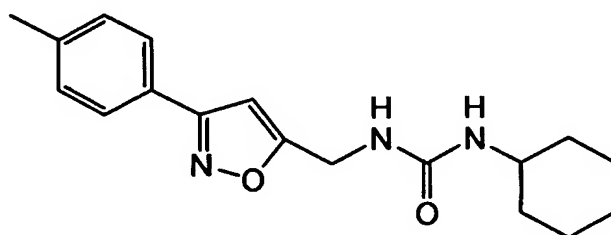
- 5 実施例 17 (18) : 1- [(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル) メチル] -3-フェニル-3-メチル尿素の製造 (化合物番号 II-4) :



性状：油状，

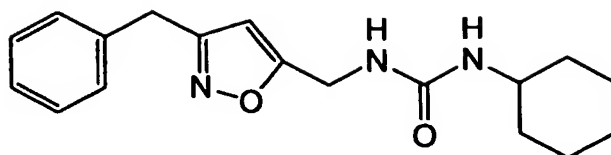
NMR : δ 1.24(6H, d), 2.72-3.21(1H, m), 4.42(2H, d), 4.77-5.04(1H, brs), 5.99(1H, s), 7.10-7.52(5H, m)。

- 10 実施例 17 (19) : 1- { [3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル] メチル} -3-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II-9) :



融点：163～170℃。

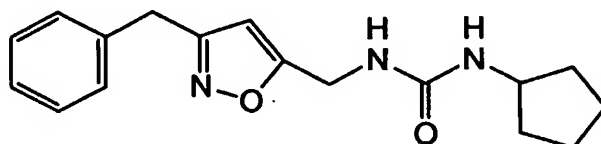
- 15 実施例 17 (20) : 1- [(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル) メチル] -3-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II-13) :



性状：油状,

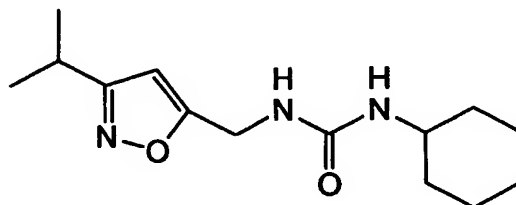
NMR : δ 0.80-2.05(10H, m), 3.22-3.68(1H, brs), 3.92(2H, s), 4.35(2H, d), 5.23(1H, brt), 7.20(5H, brs)。

- 5 実施例 17 (21) : 1-[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-シクロペンチル尿素の製造 (化合物番号 II-14) :



融点：125～129℃。

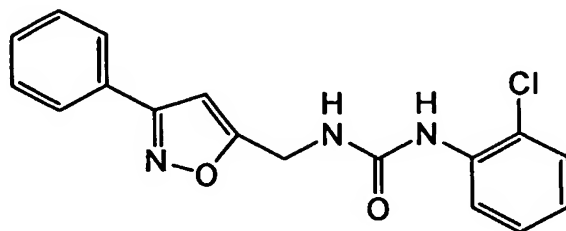
- 10 実施例 17 (22) : 1-[(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II-15) :



性状：油状,

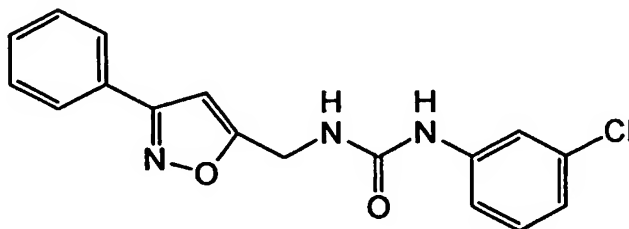
NMR : δ 0.48-2.08(16H, m), 3.28-3.63(2H, m), 4.35-4.60(1H, brs), 4.43(2H, d), 4.90(1H, Brt), 6.12(1H, s)。

実施例 17 (23) : 1-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-(2-クロルフェニル)尿素の製造 (化合物番号 II-48) :



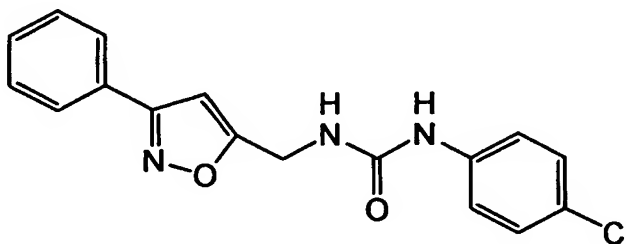
融点 : 166 ~ 169°C。

5 実施例 17 (24) : 1-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-(3-クロルフェニル)尿素の製造 (化合物番号 II-49) :



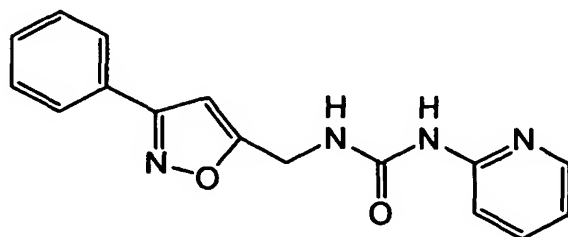
NMR : δ 4.58(2H, d) 6.51(1H, s) 6.82-7.86(10H, m) 8.08(1H, brs)。

10 実施例 17 (25) : 1-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-(4-クロルフェニル)尿素の製造 (化合物番号 II-50) :



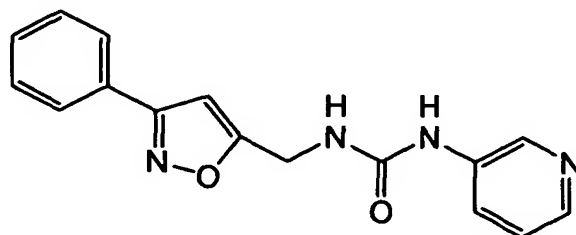
融点 : 212 ~ 219°C。

実施例 17 (26) : 1-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-(2-ピリジル)尿素の製造 (化合物番号 II-99) :



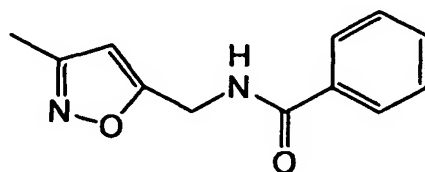
融点 : 211~212℃。

5 実施例 17 (27) : 1-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-(3-ピリジル)尿素の製造 (化合物番号 II-100) :



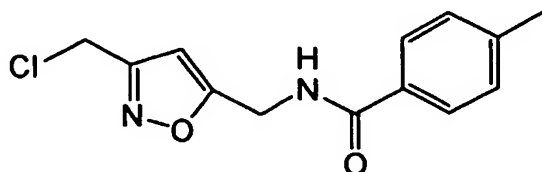
融点 : 186~188℃。

10 実施例 17 (28) : N-[(3-メチル-5-イソオキサゾリル)メチル]安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-1) :



融点 : 106~107℃。

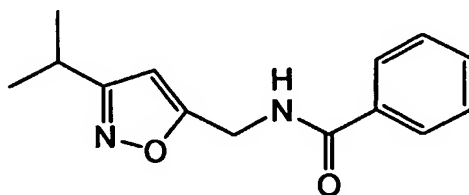
実施例 17 (29) : N-[(3-クロルメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-2) :



性状 : ペースト,

5 NMR : δ 2.39(3H, s), 4.53(2H, s), 4.72(2H, d), 6.32(1H, s), 6.63-6.92(1H, brs), 7.21(2H, d), 7.68(2H, d)。

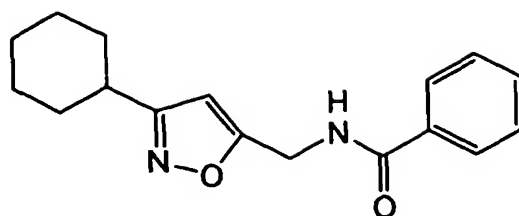
実施例 17 (30) : N-[(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-4) :



10 性状 : 油状,

NMR : δ 1.25(6H, d), 2.80-3.27(1H, m), 4.71(2H, d), 6.09(1H, s), 6.66(1H, brs), 7.28-7.88(5H, m)。

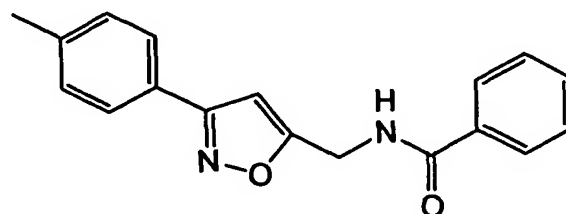
実施例 17 (31) : N-[(3-シクロヘキシル-5-イソオキサゾリル)メチル]安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-6) :



融点：89～93℃。

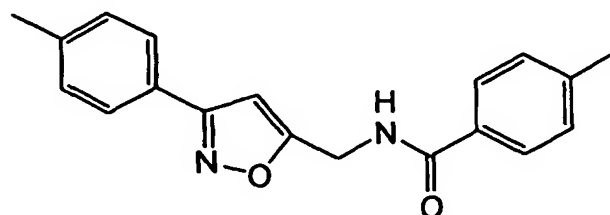
実施例17(32)：N-〔3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕安息香酸アミドの製造（化合物番号Ⅲ-10）：

5



融点：154～156℃。

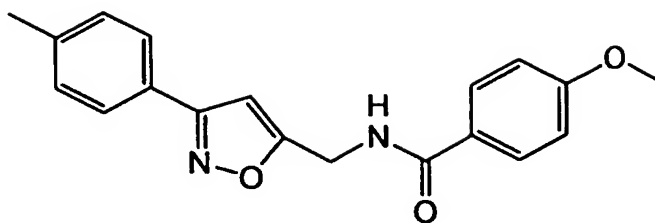
実施例17(33)：N-〔3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号Ⅲ-11）：



10 融点：164～166℃。

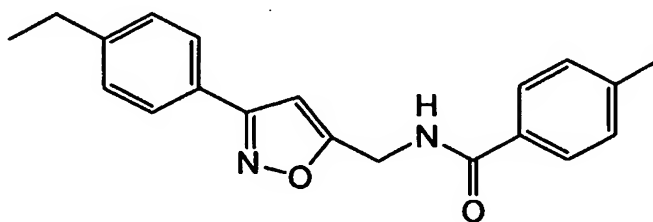
実施例17(34)：N-〔3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号Ⅲ-1

2) :



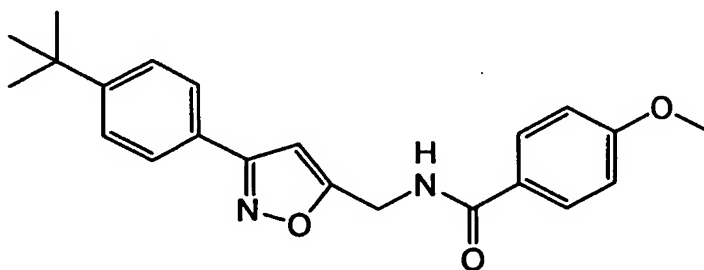
融点：174～175℃。

実施例17(35) : N- { [3-(4-エチルフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-13) :



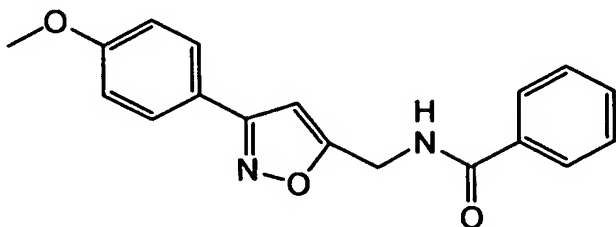
融点：150～152℃。

実施例17(36) : N- { [3-(4-tert-ブチルフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-14) :



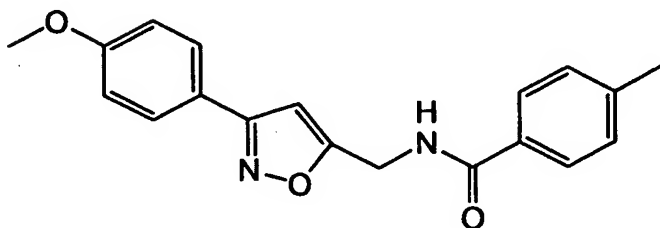
融点：179～180℃。

実施例17(37)：N-〔〔3-(4-メトキシフェニル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕安息香酸アミドの製造（化合物番号Ⅲ-17）：



5 融点：125～127℃。

実施例17(38)：N-〔〔3-(4-メトキシフェニル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号Ⅲ-19）：

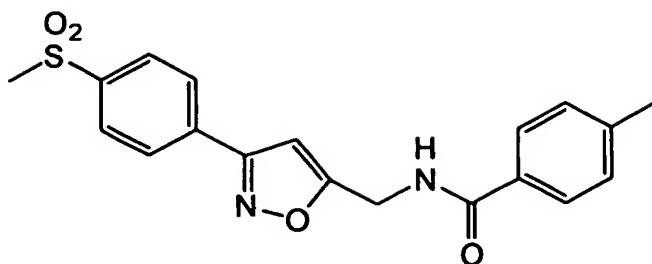


10 融点：139～142℃；

NMR： δ 2.37(3H, s), 3.81(3H, s), 4.75(2H, d), 6.43(1H, s), 6.69(1H, brs), 6.82-7.83(8H, m)。

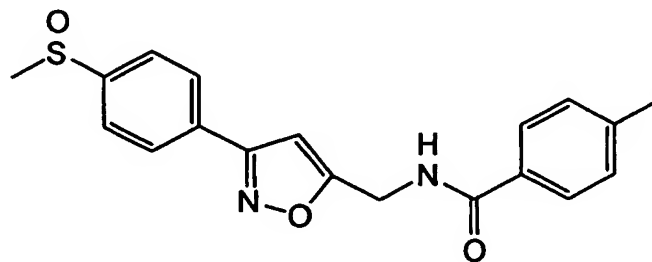
実施例17(39)：N-〔〔3-(4-メシルフェニル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号Ⅲ-2

15 6)：



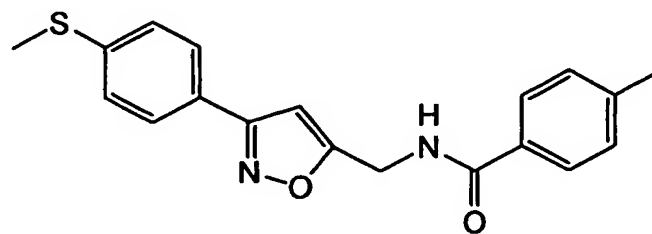
NMR : δ 2.37(3H, s), 3.08(3H, s), 4.78(2H, d), 6.61(1H, s), 7.09-8.08(9H, m)。

実施例 17 (40) : N- { [3 - (4 - メタンスルフィニルフェニル) -
5 - イソオキサゾリル] メチル } - 4 - メチル安息香酸アミドの製造 (化
5 物番号 III - 27) :



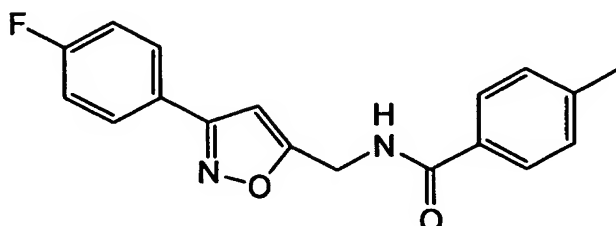
NMR : δ 2.37(3H, s), 2.72(3H, s), 4.78(2H, d), 5.99(1H, s), 7.09-8.08(9H, m)。

実施例 17 (41) : N- { [3 - (4 - メチルチオフェニル) - 5 - イソ
オキサゾリル] メチル } - 4 - メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III
10 - 28) :



融点 : 135 ~ 155℃。

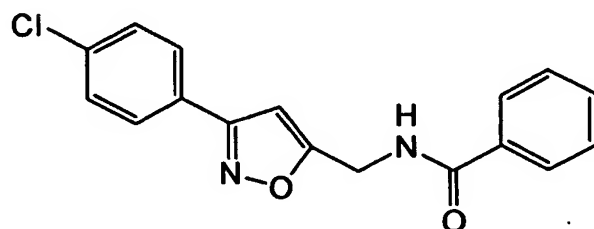
実施例 17 (42) : N- { [3- (4-フルオロフェニル) - 5-イソオキサゾリル] メチル } - 4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-31) :



5 融点 : 167 ~ 168 °C ;

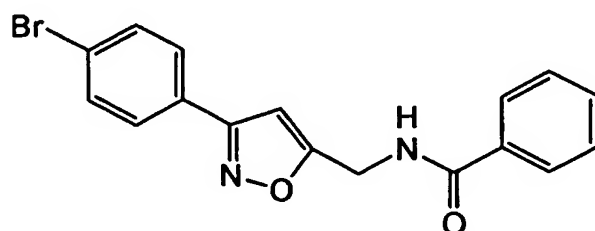
NMR : δ 2.67(3H, s), 4.78(2H, d), 6.50(1H, s), 6.60-7.93(9H, m)。

実施例 17 (43) : N- { [3- (4-クロルフェニル) - 5-イソオキサゾリル] メチル } 安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-34) :



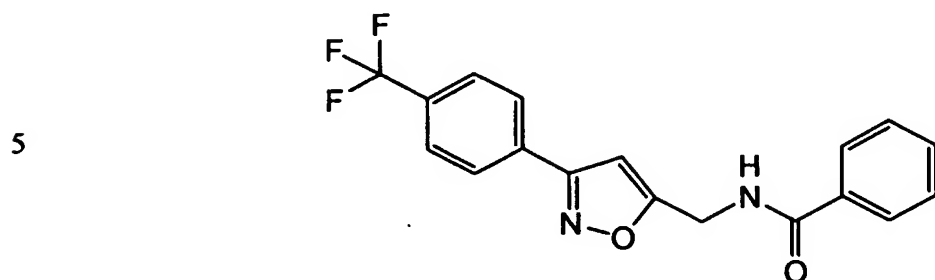
10 融点 : 172 ~ 173 °C。

実施例 17 (44) : N- { [3- (4-ブロモフェニル) - 5-イソオキサゾリル] メチル } 安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-37) :



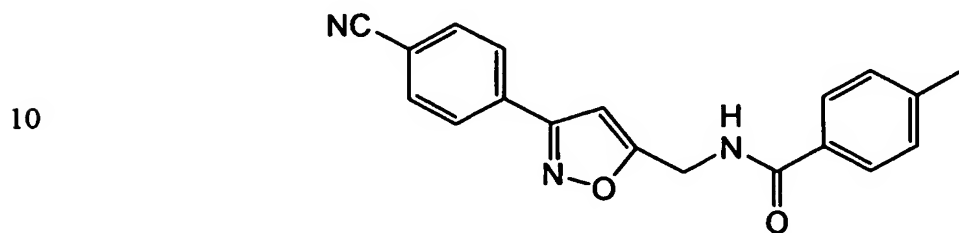
融点：184～187℃。

実施例17(45)：N-〔3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕安息香酸アミドの製造(化合物番号Ⅲ-40)：



融点：179～180℃。

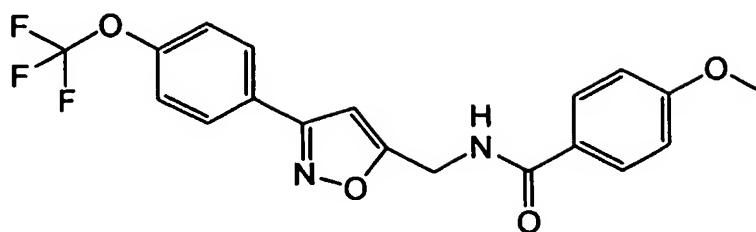
実施例17(46)：N-〔3-(4-シアノフェニル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メチル安息香酸アミドの製造(化合物番号Ⅲ-43)：



NMR： δ 2.33(3H, s), 4.79(2H, d), 6.44-6.85(1H, br), 6.59(1H, s), 7.10-8.87(8H, m)。

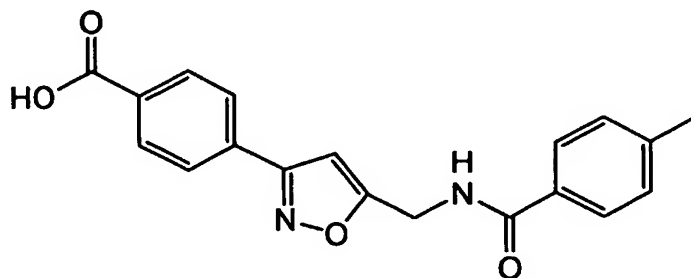
実施例17(47)：N-〔3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メトキシ安息香酸アミドの製造

(化合物番号 III-49) :



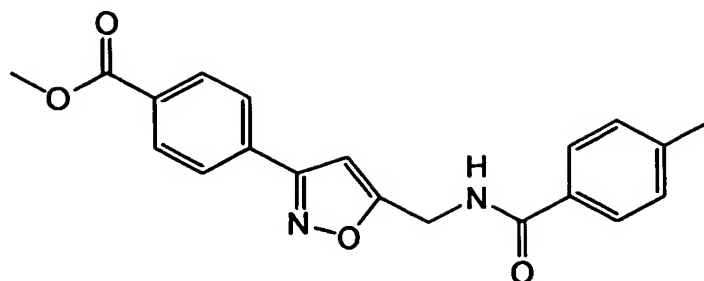
融点 : 188 ~ 191 °C。

5 実施例 17 (48) : N-{[3-(4-カルボキシフェニル)-5-イソ
オキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III
-51) :



融点 : 248 °C以上 (分解)。

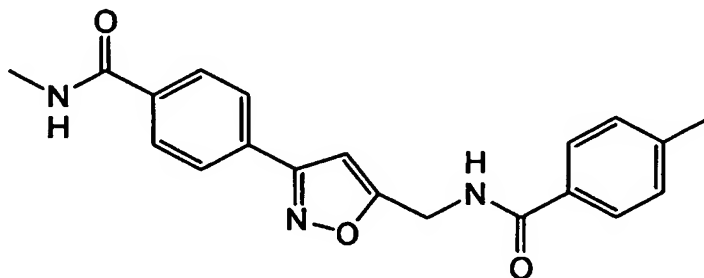
10 実施例 17 (49) : N-{[3-(4-メトキシカルボニルフェニル)-
5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造 (化
合物番号 III-52) :



融点：173～175℃；

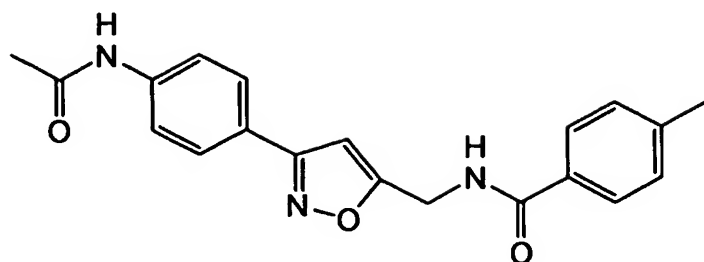
NMR： δ 2.34(3H, s), 3.92(3H, d), 4.76(2H, d), 6.53(1H, s), 6.92-8.15(9H, m)。

実施例17(50)：N-{[3-(4-メチルアミノカルボニルフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造
5 (化合物番号III-54)：



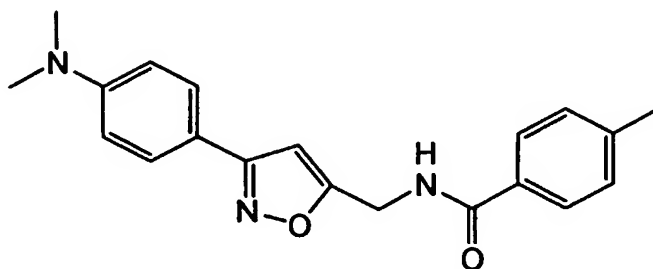
融点：261～262℃。

実施例17(51)：N-{[3-(4-アセトアミドフェニル)-5-イ
10 ソオキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号
III-57)：



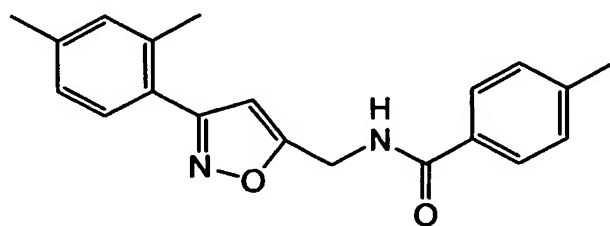
融点：>200℃。

実施例 17 (52) : N- { [3 - (4 - ジメチルアミノフェニル) - 5 -
イソオキサゾリル] メチル } - 4 - メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番
5 号 III-61) :



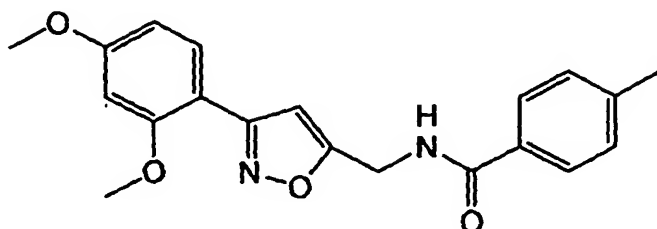
NMR : δ 2.33(3H, s), 2.99(6H, s), 4.74(2H, d), 6.46(1H, s), 6.53-8.07(9H, m)。

実施例 17 (53) : N- { [3 - (2 , 4 - ジメチルフェニル) - 5 - イ
ソオキサゾリル] メチル } - 4 - メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号
10 III-65) :



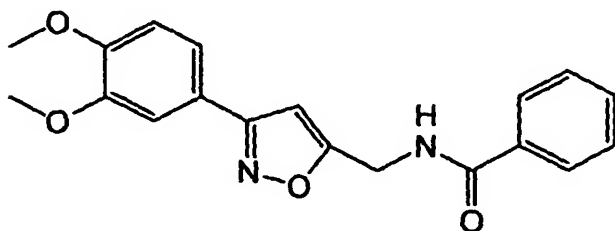
融点：138～140℃。

実施例 17 (54) : N- { [3- (2, 4-ジメトキシフェニル) -5-
イソオキサゾリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番
号 III-66) :



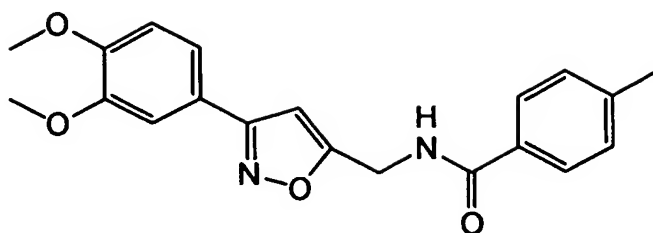
5 融点 : 157 ~ 158℃。

実施例 17 (55) : N- { [3- (3, 4-ジメトキシフェニル) -5-
イソオキサゾリル] メチル} 安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-6
7) :



10 融点 : 122 ~ 130℃。

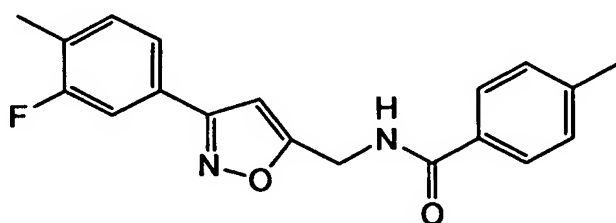
実施例 17 (56) : N- { [3- (3, 4-ジメトキシフェニル) -5-
イソオキサゾリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番
号 III-68) :



融点：160～162℃；

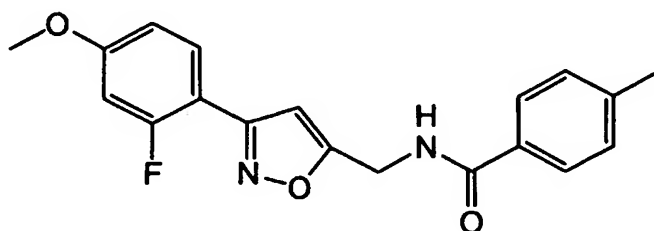
NMR： δ 2.32(3H, s), 3.82(6H, s), 4.72(2H, d), 6.43(1H, s), 6.72-7.83(8H, m)。

- 5 実施例17(57)：N-{[3-(3-フルオロ-4-メチルフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号III-73）：



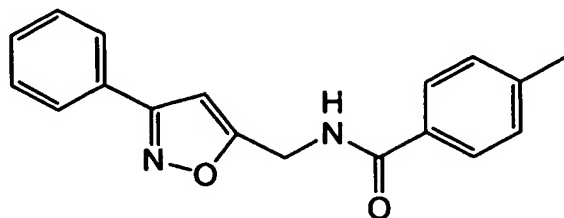
融点：165～166℃。

- 10 実施例17(58)：N-{[3-(2-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号III-74）：



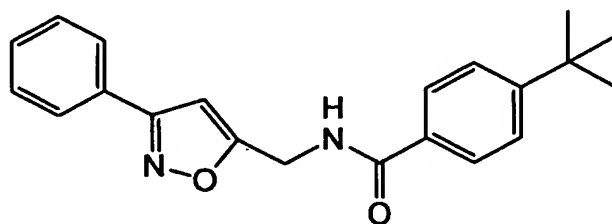
融点：154～155℃。

実施例 17 (59) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-107) :



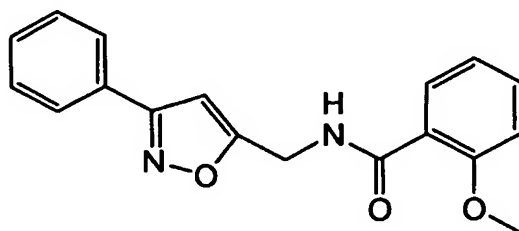
融点 : 154 ~ 156 °C。

5 実施例 17 (60) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-tert-ブチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-108) :



融点 : 135 ~ 140 °C。

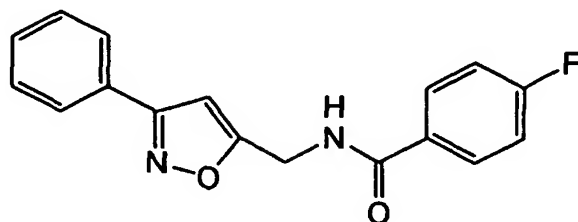
10 実施例 17 (61) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-109) :



性状 : 油状,

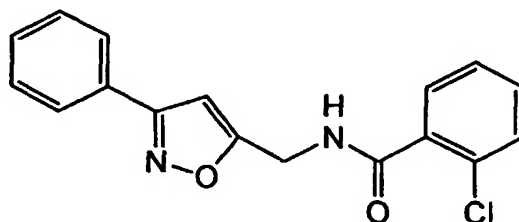
NMR : δ 4.00(3H, s) 4.81(2H, d) 6.53(1H, s) 6.87-8.55(10H, m)。

実施例 17 (62) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-フルオロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-121) :



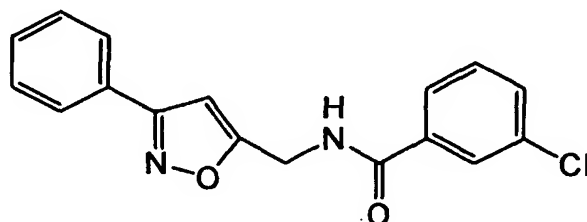
融点 : 126 ~ 131℃。

5 実施例 17 (63) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-クロル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-122) :



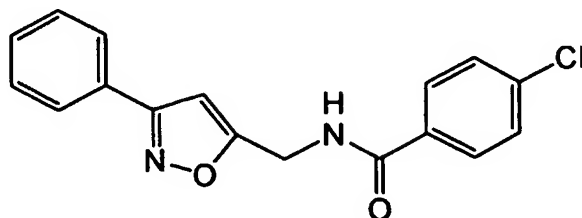
融点 : 170 ~ 175℃。

10 実施例 17 (64) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-クロル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-123) :



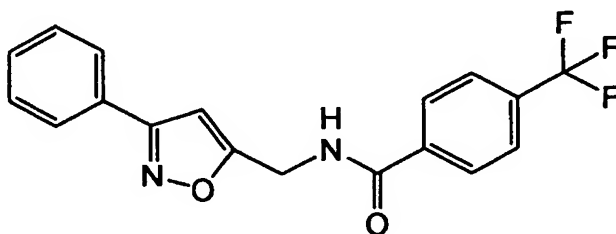
融点 : 113 ~ 115℃。

実施例 17 (65) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-クロル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-124) :



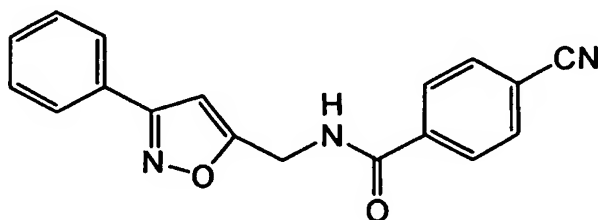
融点 : 148 ~ 151 °C。

- 5 実施例 17 (66) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-トリフルオロメチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-130) :



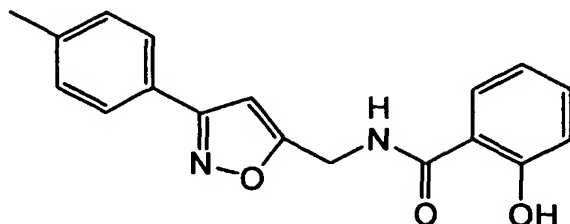
融点 : 157 ~ 168 °C。

- 10 実施例 17 (67) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-シアノ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-133) :



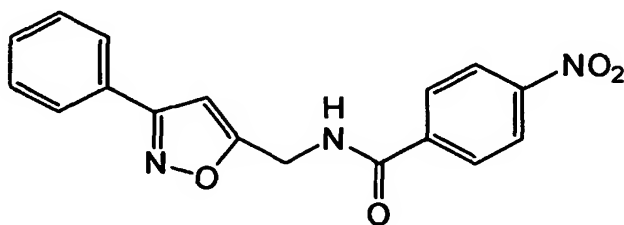
融点 : 144 ~ 145 °C。

実施例 17 (68) : N-[(3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-ヒドロキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-134) :



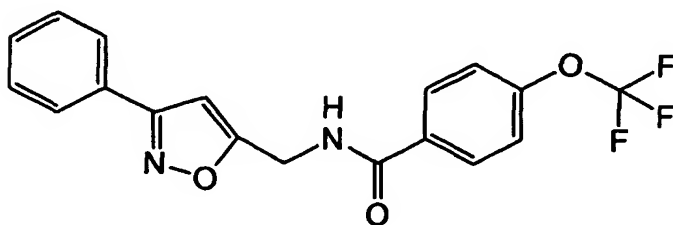
5 融点 : 120 ~ 132℃。

実施例 17 (69) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-ニトロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-137) :



融点 : 166 ~ 174℃。

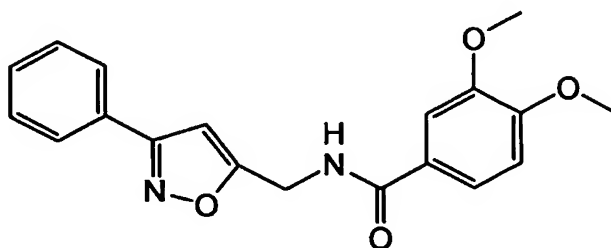
10 実施例 17 (70) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-トリフルオロメトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-139) :



融点：140～141℃。

実施例17(71)：N-〔(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル〕-3,4-ジメトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号Ⅲ-156)：

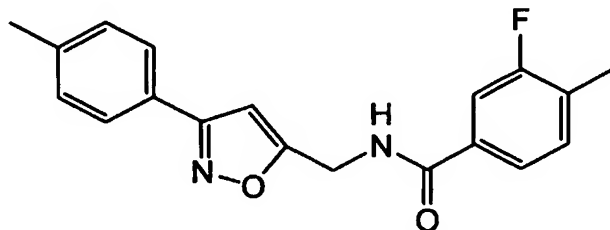
5



融点：157～169℃。

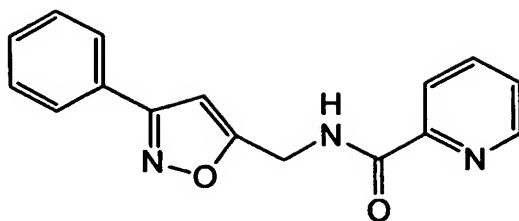
実施例17(72)：N-〔〔3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-3-フルオロ-4-メチル安息香酸アミドの製造(化合物番号Ⅲ-162)：

10



融点：148～154℃。

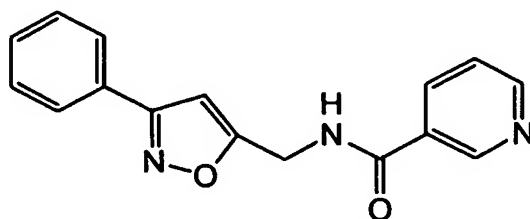
実施例17(73)：(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル-2-ピリジンの製造(化合物番号Ⅲ-174)：



融点：125～127℃。

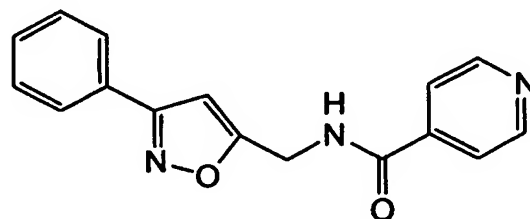
実施例17(74)：(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル-3-ピリジンの製造(化合物番号III-175)：

5



融点：130～132℃。

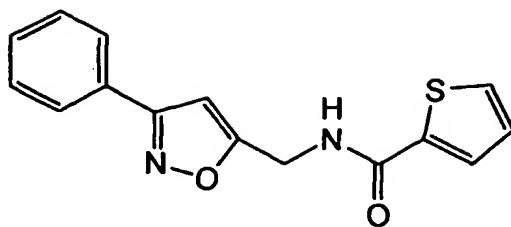
実施例17(75)：(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル-4-ピリジンの製造(化合物番号III-176)：



10

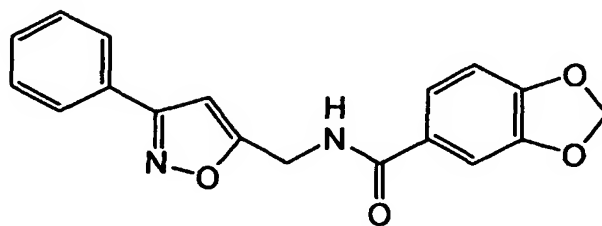
融点：125～135℃。

実施例17(76)：(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル-2-チオフェンの製造(化合物番号III-177)：



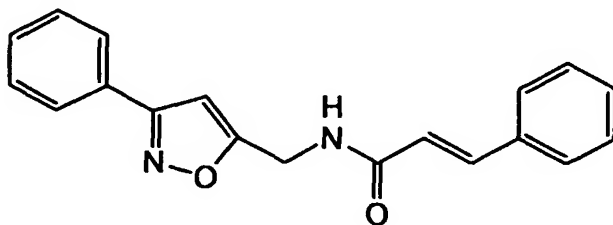
融点：141～155℃。

実施例17(77)：5-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル
アミノカルボニル-1,3-ベンゾジオキソールの製造(化合物番号Ⅲ-1
5 80)：



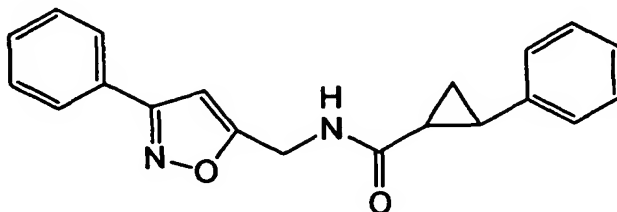
融点：175～183℃。

実施例17(78)：(E)-N-[5-(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-フェニルプロペン酸アミドの製造(化合物番号Ⅲ-20
10 1)：



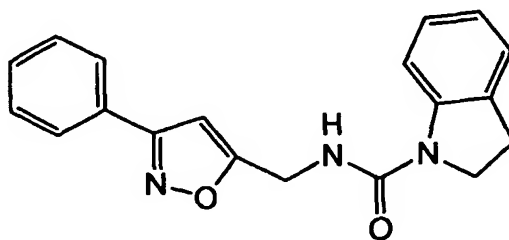
融点：155～157℃。

実施例 17 (79) : 1-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル]-2-フェニルシクロプロパンの製造 (化合物番号 III-202) :



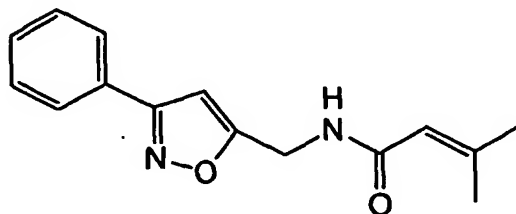
5 融点 : 152 ~ 154 °C。

実施例 17 (80) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチルアミノカルボニル]インドリンの製造 (化合物番号 III-208) :



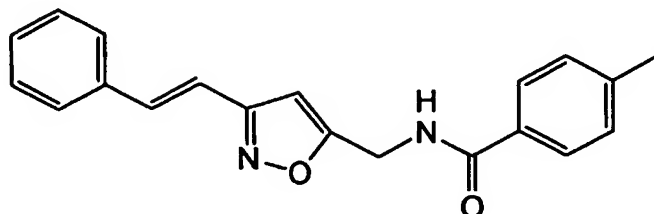
融点 : 137 ~ 139 °C。

10 実施例 17 (81) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-メチル-2-ブテン酸アミドの製造 (化合物番号 III-209) :



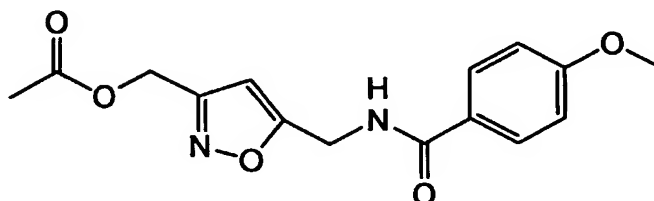
融点 : 97 ~ 98 °C。

実施例 17 (82) : N- { [3- (2-フェニルエテニル) - 5-イソオキサゾリル] メチル } - 4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-210) :



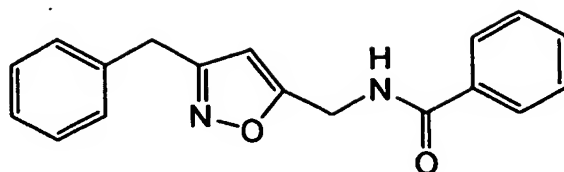
5 融点 : 151 ~ 156 °C。

実施例 17 (83) : N- [(3-アセチルオキシメチル-5-イソオキサゾリル) メチル] - 4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-211) :



10 性状 : ペースト,
NMR : δ 2.09(3H, s), 3.80(3H, s), 4.68(2H, d), 5.09(2H, d), 6.21(1H, s), 6.87(2H, d), 7.19-7.40(1H, brt), 7.78(2H, d)。

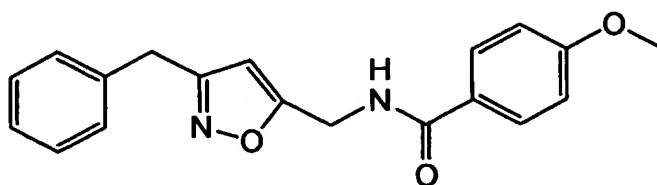
実施例 17 (84) : N- [(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル) メチル] 安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-1) :



性状：油状,

NMR : δ 3.92(2H, s), 4.61(2H, d), 5.94(1H, s), 6.83-7.88(11H, m)。

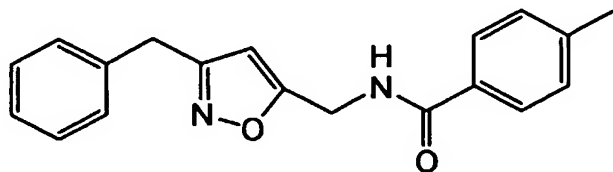
- 5 実施例 17 (85) : N-[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-2) :



性状：油状,

NMR : δ 3.80(3H, s), 3.93(2H, s), 4.61(2H, d), 5.98(1H, s), 6.86(2H, d), 7.21(5H, s), 7.73(2H, d)。

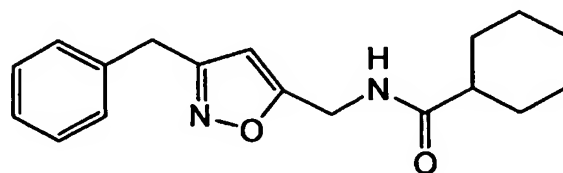
- 10 実施例 17 (86) : N-[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-3) :



融点：119～124℃。

実施例 17 (87) : (3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチルアミ

ノカルボニルシクロヘキサンの製造（化合物番号 IV-4）：

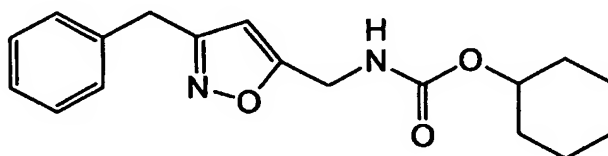


性状：油状，

NMR： δ 1.06-2.30(11H, m), 3.99(2H, s), 4.50(2H, d), 5.71-6.04(1H, br),
 5 5.89(1H, s), 7.21(5H, s)。

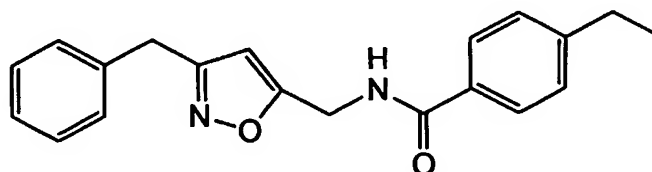
実施例 17 (88)：[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]

カルバミン酸シクロヘキシルの製造（化合物番号 IV-5）：



融点：98～104℃。

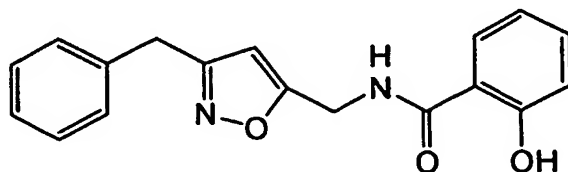
10 実施例 17 (89)：N-[(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル)メチル]
 ル] 4-エチル安息香酸アミドの製造（化合物番号 IV-6）：



性状：油状，

NMR： δ 1.22(3H, t), 2.70(2H, q), 3.93(2H, s), 4.67(2H, d), 5.99(1H, s), 6.40-
 15 6.72(1H, brs), 7.08-7.47(7H, m), 7.69(2H, d)。

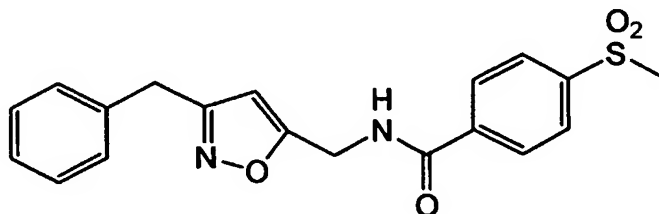
実施例 17 (90) : N- [(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル) メチル] -2-ヒドロキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-7) :



性状 : ペースト,

5 NMR : δ 3.92(2H, s), 4.60(2H, d), 5.99(1H, s), 6.47-7.56(10H, m), 11.4(1H, s)。

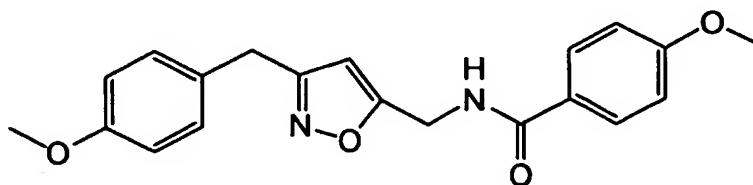
実施例 17 (91) : N- [(3-ベンジル-5-イソオキサゾリル) メチル] -4-メシル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-8) :



融点 : 148 ~ 157 °C ;

10 NMR : δ 3.04(3H, s), 3.97(2H, s), 4.69(2H, d), 6.01(1H, s), 6.95-7.55(6H, m), 7.93(4H, s)。

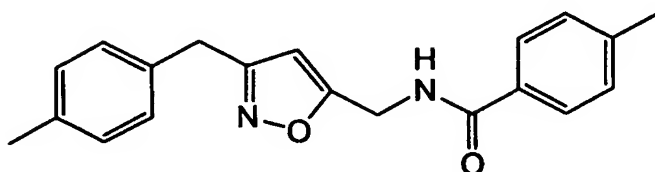
実施例 17 (92) : N- { [3-(4-メトキシベンジル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-9) :



融点：114～117℃。

実施例17(93)：N-〔〔3-(4-メチルベンジル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号 IV-10）：

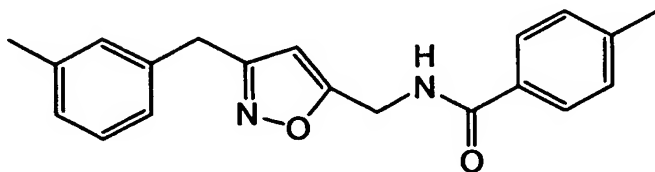
5



融点：86～97℃。

実施例17(94)：N-〔〔3-(3-メチルベンジル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号 IV-11）：

10

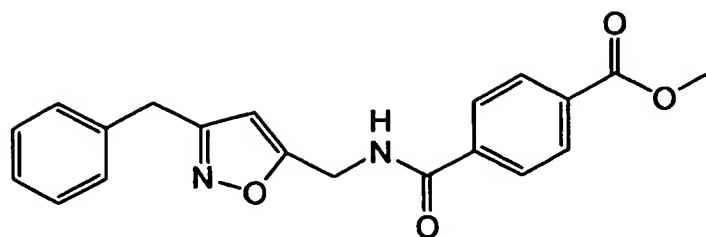


性状：油状，

NMR： δ 2.31(3H, s), 2.40(3H, s), 3.92(2H, s), 4.65(2H, d), 5.99(1H, s), 6.53-6.87(1H, brs), 6.87-7.86(8H, m)。

実施例17(95)：N-〔〔3-ベンジル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メトキシカルボニル安息香酸アミドの製造（化合物番号 IV-23）：

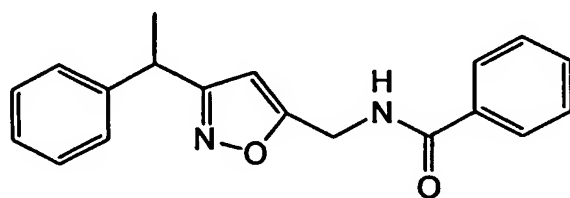
15



融点：134～140℃。

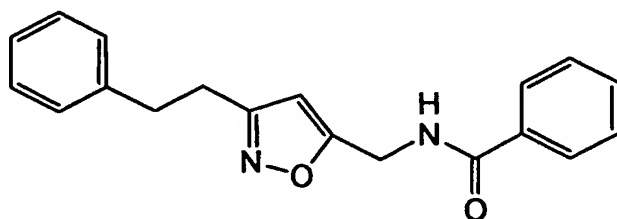
実施例17(96)：N-{[3-(1-フェニルエチル)-5-イソオキサゾリル]メチル}安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-29)：

5



融点：100～107℃。

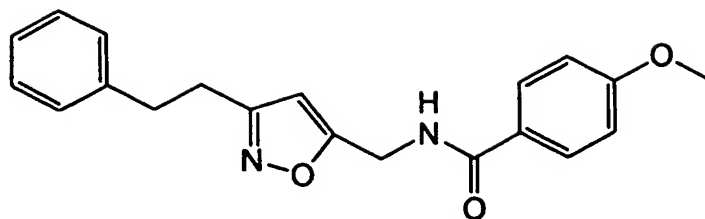
実施例17(97)：N-{[3-(2-フェニルエチル)-5-イソオキサゾリル]メチル}安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-33)：



10 融点：53～83℃。

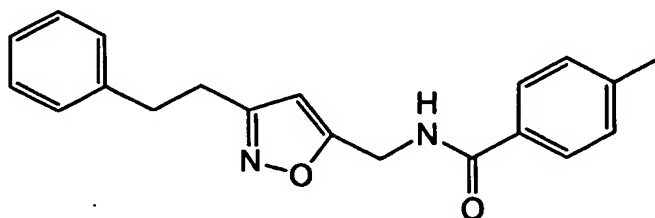
実施例17(98)：N-{[3-(2-フェニルエチル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV

— 34) :



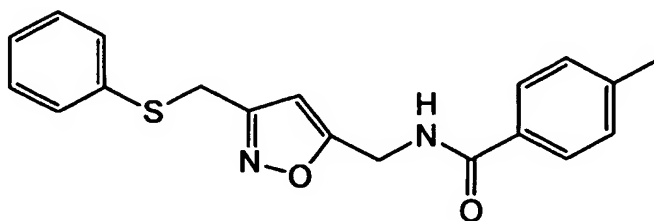
融点：119～131℃。

実施例17(99) : N- { [3-(2-フェニルエチル) -5-イソオキサ
5 ソリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-
35) :



融点：131～137℃。

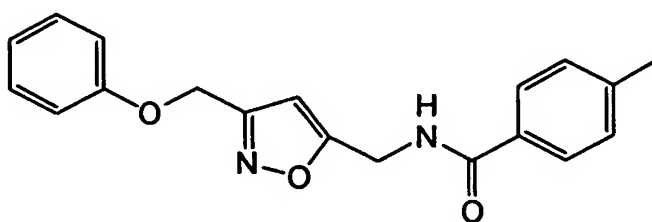
実施例17(100) : N- [(3-フェニルチオメチル-5-イソオキサ
10 ソリル) メチル] -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-4
0) :



融点：79～85℃；

NMR : δ 2.40(3H, s), 4.04(2H, s), 4.62(2H, d), 6.13(1H, s), 6.76(1H, s), 7.03-7.74(10H, m)。

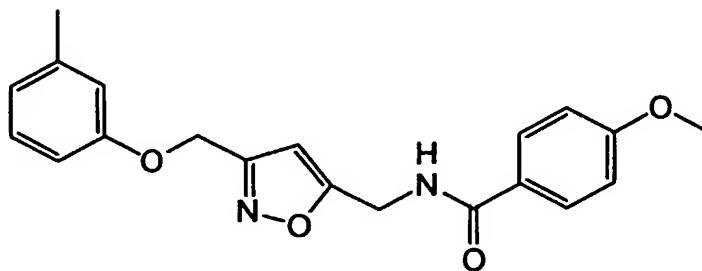
実施例 17 (101) : N- [(3-フェノキシメチル-5-イソオキサゾリル) メチル] -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-4
5 6) :



性状 : ペースト,

NMR : δ 2.36(3H, s), 4.67(2H, d), 5.07(2H, s), 6.30(1H, s), 6.52-7.78(10H, m)。

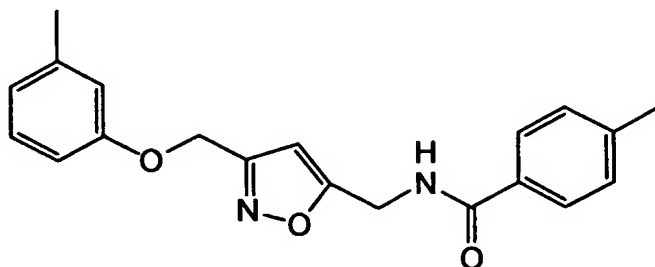
実施例 17 (102) : N- { [3- (3-メチルフェニル) オキシメチル
10 -5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メトキシ安息香酸アミドの製造
(化合物番号 IV-48) :



融点 : 86 ~ 90°C ;

NMR : δ 2.25(3H, s), 3.75(3H, s), 4.62(2H, s), 5.00(2H, s), 6.27(1H, s), 6.60-
15 7.83(9H, m)。

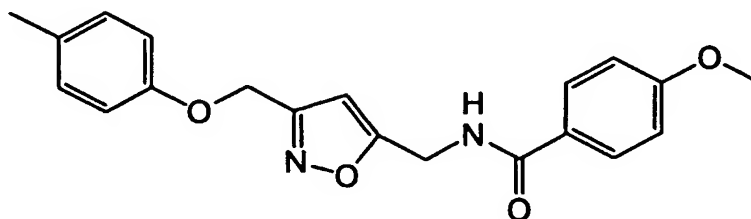
実施例 17 (103) : N- { [3- (3-メチルフェニル) オキシメチル
-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メチル安息香酸アミドの製造 (化
合物番号 IV-49) :



5 融点 : 94 ~ 96 °C ;

NMR : δ 2.31(3H, s), 2.35(3H, s), 4.72(2H, d), 5.05(2H, s), 6.33(1H, s), 6.61-7.76(9H, m)。

実施例 17 (104) : N- { [3- (4-メチルフェニル) オキシメチル
-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造
10 (化合物番号 IV-50) :

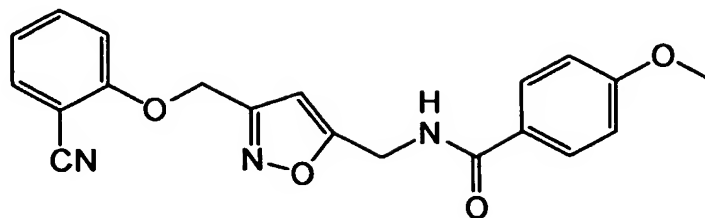


融点 : 124 ~ 127 °C ;

NMR : δ 2.27(3H, s), 3.80(3H, s), 4.68(2H, s), 5.03(2H, s), 6.33(1H, s), 6.64-8.00(9H, m)。

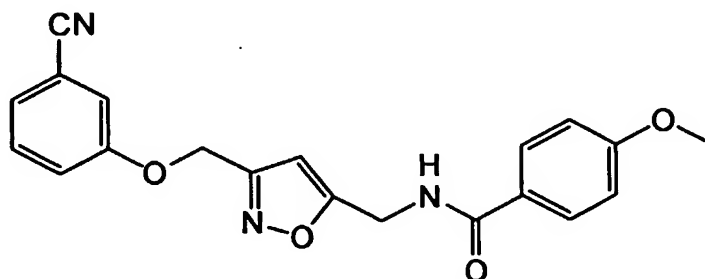
15 実施例 17 (105) : N- { [3- (2-シアノフェニル) オキシメチル

－５－イソオキサゾリル] メチル} －４－メトキシ安息香酸アミドの製造
(化合物番号 IV－５１) :



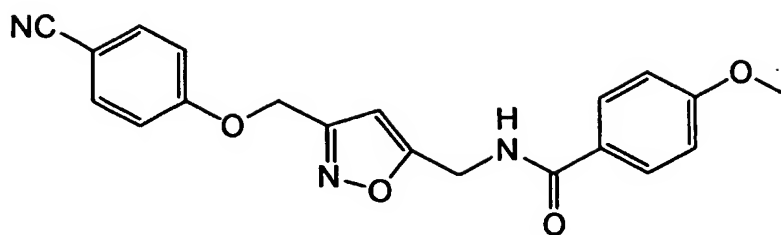
融点：１１１～１１４℃。

- ５ 実施例１７（１０６）：N－{[3－（３－シアノフェニル）オキシメチル－５－イソオキサゾリル] メチル} －４－メトキシ安息香酸アミドの製造
(化合物番号 IV－５２) :



融点：１２８～１３０℃。

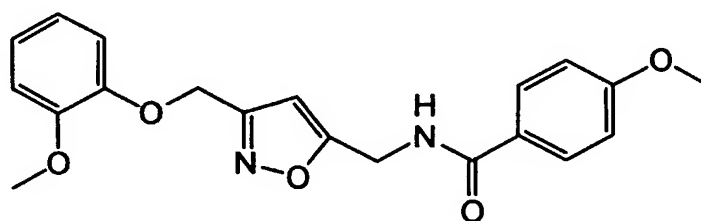
- １０ 実施例１７（１０７）：N－{[3－（４－シアノフェニル）オキシメチル－５－イソオキサゾリル] メチル} －４－メトキシ安息香酸アミドの製造
(化合物番号 IV－５３) :



融点：119～121℃；

NMR： δ 3.81(3H, s), 4.72(2H, d), 5.14(2H, s), 6.32(1H, s), 6.73-8.02(9H, m)。

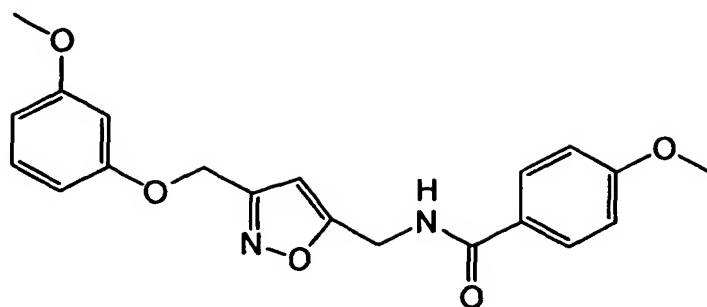
- 5 実施例17(108)：N-{[3-(2-メトキシフェニル)オキシメチルー5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造
(化合物番号IV-54)：



性状：油状，

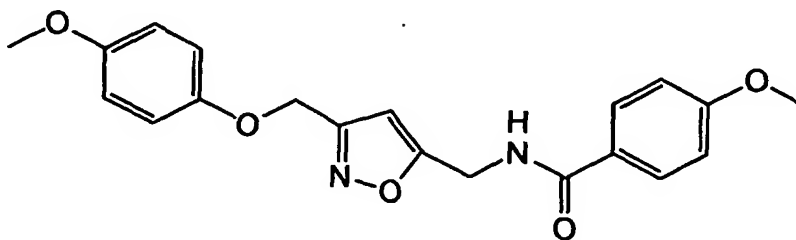
NMR： δ 3.75(6H, s), 4.60(2H, d), 5.07(2H, s), 6.28(1H, s), 6.69-7.90(9H, m)。

- 10 実施例17(109)：N-{[3-(3-メトキシフェニル)オキシメチルー5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造
(化合物番号IV-55)：



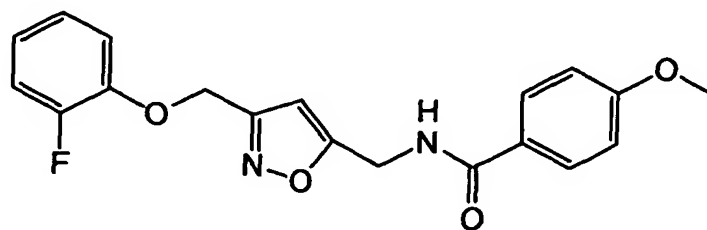
融点：95～104℃。

実施例17(110)：N-{[3-(4-メトキシフェニル)オキシメチ
ル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造
5 (化合物番号IV-56)：



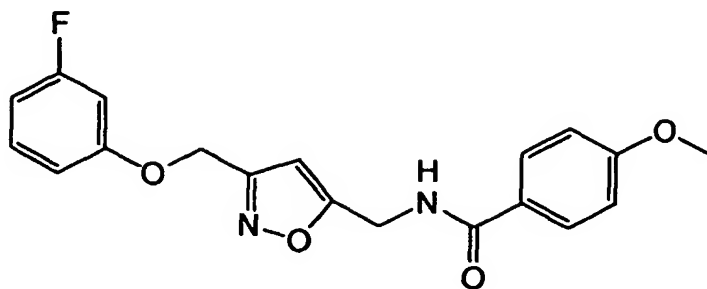
融点：115～121℃。

実施例17(111)：N-{[3-(2-フルオロフェニル)オキシメチ
ル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造
10 (化合物番号IV-57)：



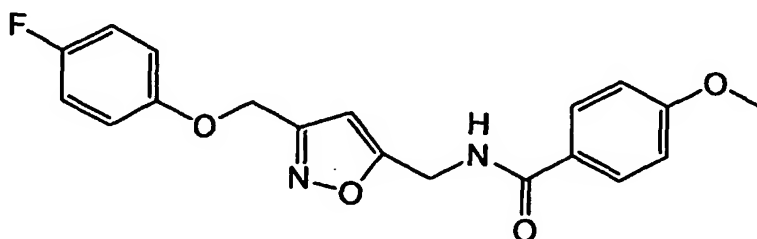
融点：97～102℃。

実施例 17 (112) : N- { [3- (3-フルオロフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造
(化合物番号 IV-58) :



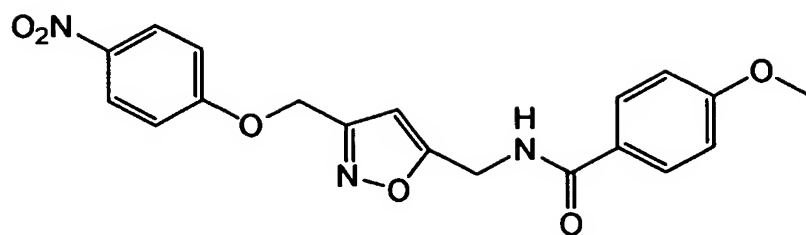
5 融点 : 95 ~ 106℃。

実施例 17 (113) : N- { [3- (4-フルオロフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造
(化合物番号 IV-59) :



10 融点 : 95 ~ 106℃。

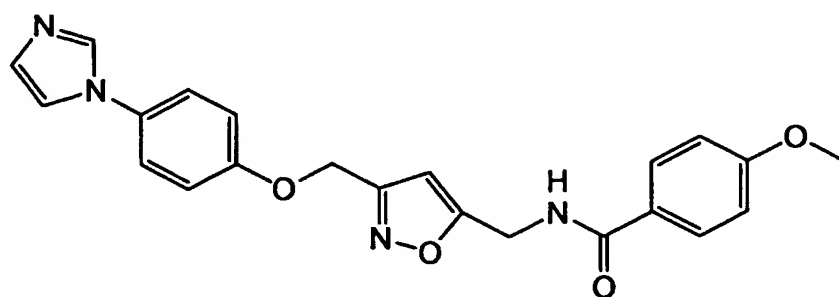
実施例 17 (114) : N- { [3- (4-ニトロフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造
(化合物番号 IV-60) :



融点：151～154℃。

実施例17(115)：N-〔3-(イミダゾール-2-イルフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル〕メチル-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-72)：

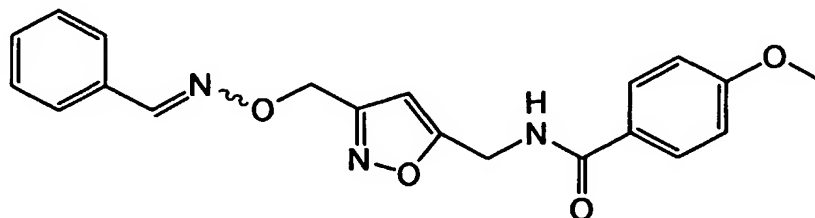
5 ミドの製造(化合物番号IV-72)：



融点：138～142℃，

NMR： δ 3.80(3H, s), 4.70(2H, d), 5.08(2H, s), 6.32(1H, s), 6.78-7.93(12H, m)。

10 実施例17(116)：〔3-〔(4-メトキシフェニル)カルボニルアミノメチル〕-5-イソオキサゾリル〕メトキシイミノベンジルの製造(化合物番号IV-74)：



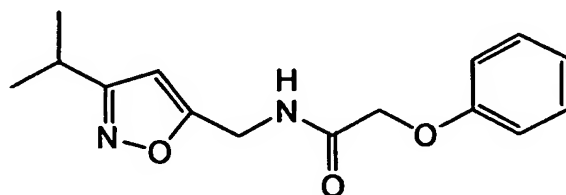
性状：アモルファス，

NMR： δ 3.76(3H, s), 4.65(2H, d), 5.18(2H, s), 5.32(1H, s), 6.25(1H, s), 6.73-8.09(11H, m)。

実施例 18

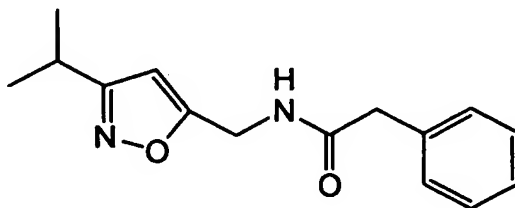
- 5 実施例 1～16 に記載の方法により、以下に示す実施例 18 (1)～18 (173) に示す化合物を得た。

実施例 18 (1)：N-[(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]フェノキシ酢酸アミドの製造(化合物番号 I-62)：



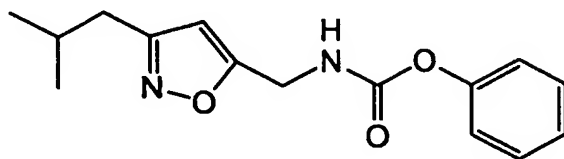
- 10 融点：80～86℃。

実施例 18 (2)：N-[(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]フェニル酢酸アミドの製造(化合物番号 I-63)：



融点：54～66℃。

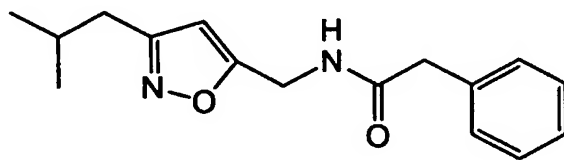
実施例 18 (3) : [(3-イソブチル-5-イソオキサゾリル) メチル]
カルバミン酸フェニルの製造 (化合物番号 I-8) :



性状 : 油状,

5 NMR : δ 0.91(3H, s), 0.99(3H, s), 1.72-2.22(1H, m), 2.52(2H, d), 4.52(2H, d), 5.47(1H, br), 6.06(1H, s), 7.02-7.48(5H, m)。

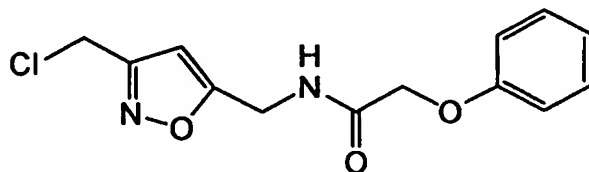
実施例 18 (4) : N- [(3-イソブチル-5-イソオキサゾリル) メチル]
フェニル酢酸アミドの製造 (化合物番号 I-64) :



10 性状 : 油状,

NMR : δ 0.88(3H, s), 0.93(3H, s), 1.72-2.14(1H, m), 2.48(2H, d), 3.59(2H, s), 4.48(2H, d), 5.88(1H, s), 7.12-7.44(5H, m)。

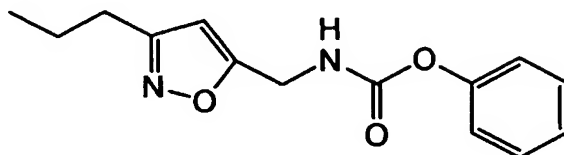
実施例 18 (5) : N- [(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル) メチル]
フェノキシ酢酸アミドの製造 (化合物番号 I-65) :



15

融点：89～99℃。

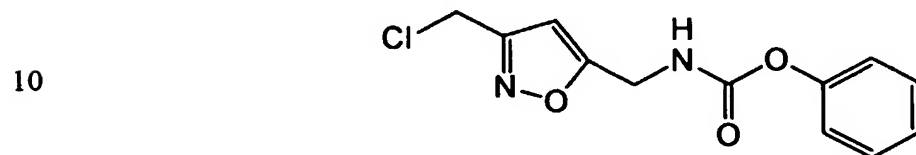
実施例 18 (6)：[(3-プロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]カルバミン酸フェニルの製造(化合物番号 I-3)：



5 性状：油状，

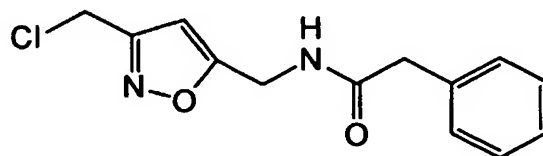
NMR： δ 0.92(3H, t), 1.43-1.88(2H, m), 2.60(2H, t), 4.48(2H, d), 5.89(1H, br), 6.07(1H, s), 7.00-7.50(5H, m)。

実施例 18 (7)：[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]カルバミン酸フェニルの製造(化合物番号 I-66)：



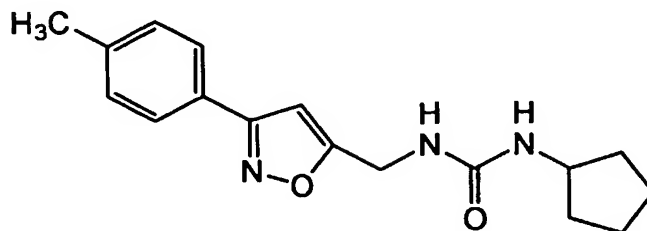
融点：79～81℃。

実施例 18 (8)：N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]フェニル酢酸アミドの製造(化合物番号 I-67)：



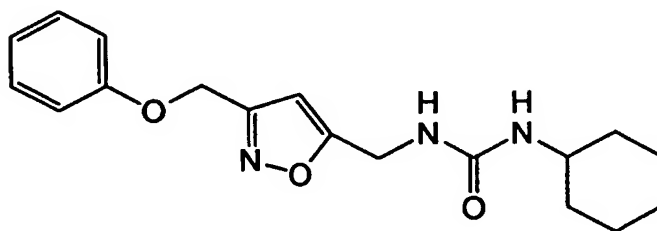
融点：102～103℃。

実施例18(9)：3-[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチルー1-シクロペンチル尿素の製造（化合物番号II-10）：



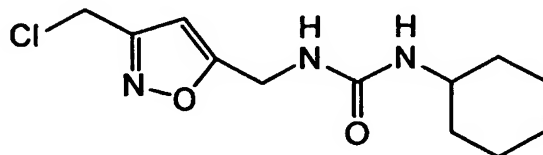
5 融点：163～164℃。

実施例18(10)：3-(3-フェノキシメチルー5-イソオキサゾリル)メチルー1-シクロヘキシル尿素の製造（化合物番号II-104）：



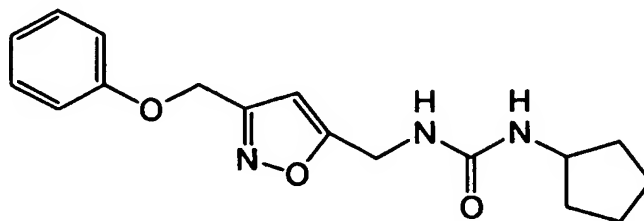
融点：137～138℃。

10 実施例18(11)：3-(3-クロロメチルー5-イソオキサゾリル)メチルー1-シクロヘキシル尿素の製造（化合物番号II-105）：



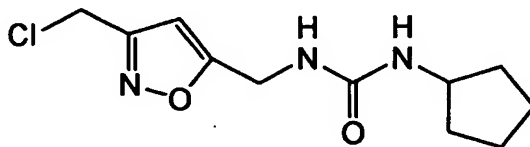
融点：96～107℃。

実施例18(12)：3-(3-フェノキシメチル-5-イソオキサゾリル)メチル-1-シクロペンチル尿素の製造(化合物番号II-106)：



5 NMR： δ 1.10-2.20(8H, m), 3.74-4.12(1H, m), 4.42(2H, d), 5.08(2H, s), 5.13(1H, br), 5.60(1H, br), 6.28(1H, s), 6.82-7.40(5H, m)。

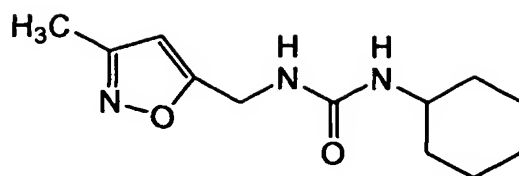
実施例18(13)：3-(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル-1-シクロペンチル尿素の製造(化合物番号II-107)：



10 性状：油状，

NMR： δ 0.72-2.20(8H, m), 3.80-4.20(1H, m), 4.50(2H, d), 4.53(2H, s), 4.40-5.35(2H, m), 6.28(1H, s)。

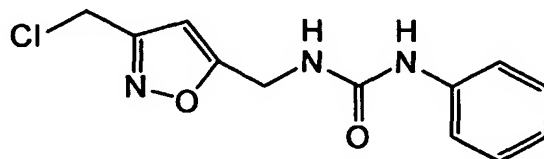
実施例18(14)：3-(3-メチル-5-イソオキサゾリル)メチル-1-シクロヘキシル尿素の製造(化合物番号II-108)：



融点：119～122℃。

実施例18(15)：3-(3-クロロメチル-5-イソキサゾリル)メチル-1-フェニル尿素の製造(化合物番号II-109)：

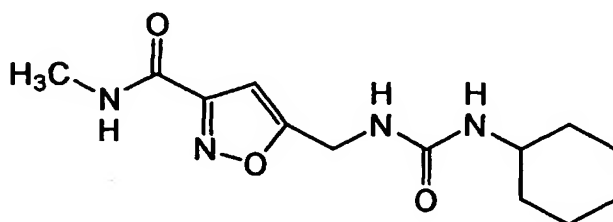
5



融点：144～146℃。

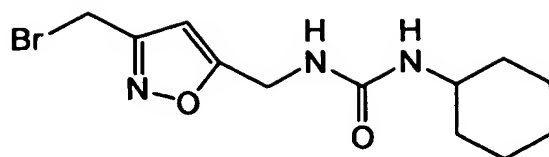
実施例18(16)：3-(3-メチルアミノカルボニル-5-イソキサゾリル)メチル-1-シクロヘキシル尿素の製造(化合物番号II-110)：

10



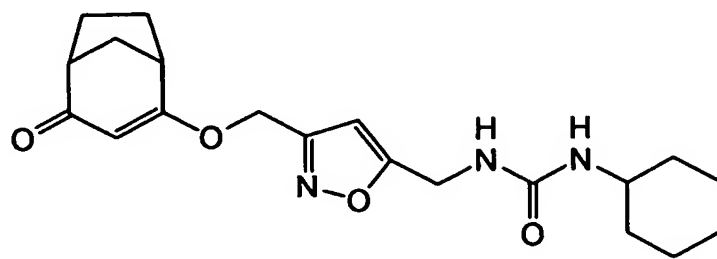
融点：197～198℃。

実施例18(17)：3-(3-ブロモメチル-5-イソキサゾリル)メチル-1-シクロヘキシル尿素の製造(化合物番号II-111)：



融点：137～139℃。

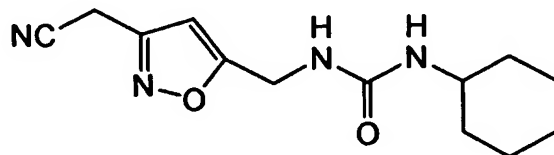
- 実施例18 (18)：3-[3-(ビシクロ[3.2.1]オクター-2-エン-4-オン-2-イル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル-1-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II-112)：



性状：ガム状,

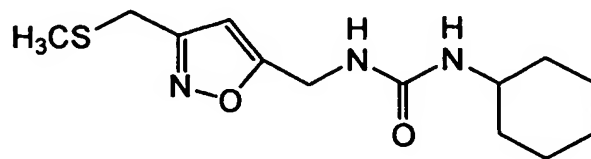
NMR： δ 0.60-2.40(16H, m), 2.90(2H, m), 3.50(1H, m), 4.50(2H, d), 4.85(2H, s), 5.00(1H, br), 5.10(1H, s), 5.50(1H, b), 6.25(1H, s)。

- 10 実施例18 (19)：3-(3-シアノメチル-5-イソオキサゾリル) メチル-1-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II-113)：



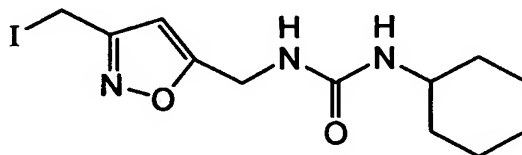
融点：140～150℃。

実施例 18 (20) : 3-(3-メチルチオメチル-5-イソオキサゾリル)メチル-1-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II-114) :



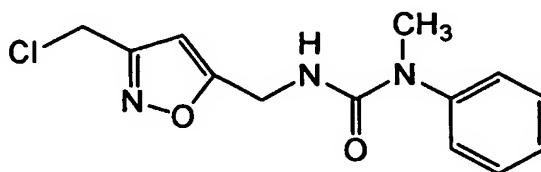
融点 : 123 ~ 130 °C。

5 実施例 18 (21) : 3-(3-ヨードメチル-5-イソオキサゾリル)メチル-1-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II-115) :



融点 : 136 ~ 139 °C。

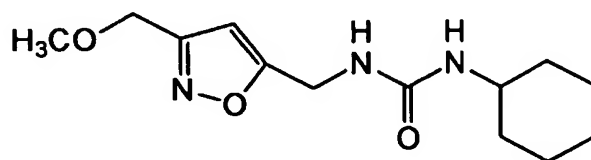
10 実施例 18 (22) : 3-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-メチル-1-フェニル尿素の製造 (化合物番号 II-116) :



性状 : 油状,

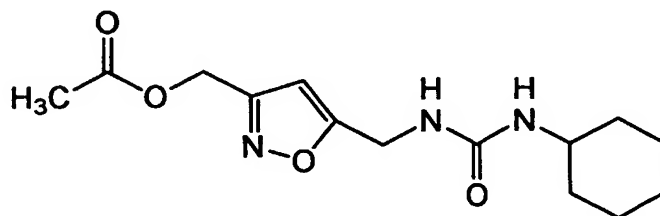
15 NMR : δ 3.25(3H,s), 4.50(2H,d), 4.55(2H,s), 4.70-4.90(1H,brs), 6.25(1H,s), 7.10-7.60(5H,m)。

実施例 18 (23) : 3-(3-メトキシメチル-5-イソオキサゾリル)メチル-1-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II-117) :



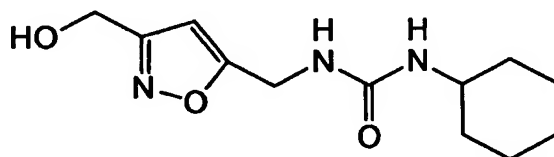
融点 : 98 ~ 99℃。

5 実施例 18 (24) : 3-(3-アセチルオキシメチル-5-イソオキサゾリル)メチル-1-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II-118) :



融点 : 89 ~ 100℃。

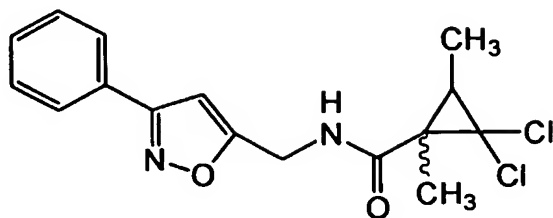
10 実施例 18 (25) : 3-(3-ヒドロキシメチル-5-イソオキサゾリル)メチル-1-シクロヘキシル尿素の製造 (化合物番号 II-119) :



融点 : 114 ~ 116℃。

実施例 18 (26) : N-[(3-フェニル-5-イソオキサゾリル) メチ

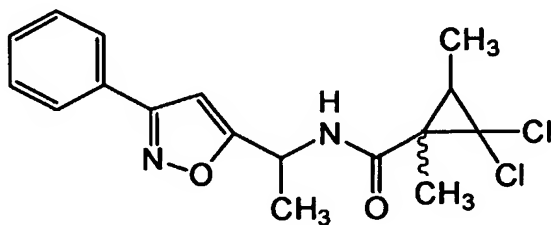
ル] - 2, 2-ジクロロ-1, 3-ジメチルシクロプロパンカーボキサミド
の製造 (化合物番号 III-212) :



性状 : 油状,

5 NMR : δ 1.07-2.50(7H, m), 4.65(2H, d), 4.61(1H, br), 6.52(1H, s), 7.32-7.87(5H, m)。

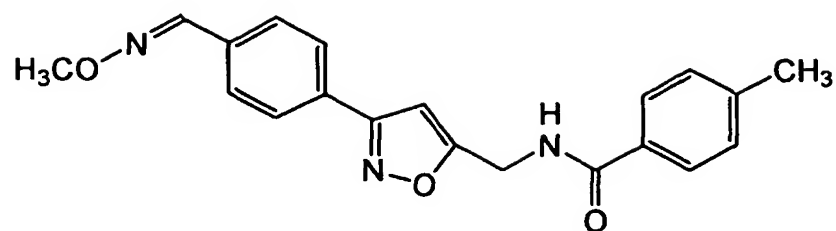
実施例 18 (27) : N-[1-(3-フェニルー5-イソオキサゾリル)
エチル] - 2, 2-ジクロロ-1, 3-ジメチルシクロプロパンカーボキサ
ミドの製造 (化合物番号 III-213) :



性状 : ガム状,

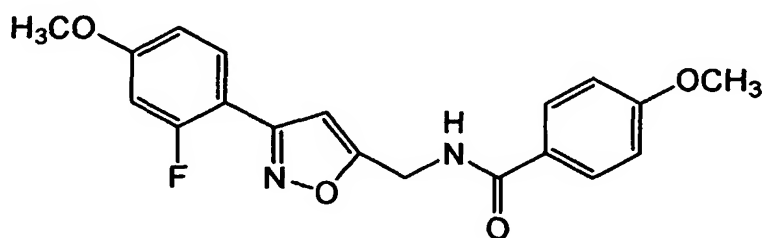
NMR : δ 1.07-2.47(10H, m), 5.21-5.65(1H, m), 6.02-6.35(1H, br), 6.41(0.5H, s),
6.48(0.5H, s), 7.32-7.89(5H, m)。

実施例 18 (28) : N-{ [3-(メトキシイミノメチル) フェニルー5
15 -イソオキサゾリル] メチル } - 4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物
番号 III-214) :



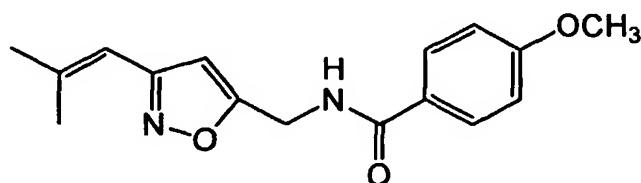
融点：154～164℃。

実施例18(29)：N-{[3-(2-フルオロ-4-メトキシフェニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-215)：



融点：129～131℃。

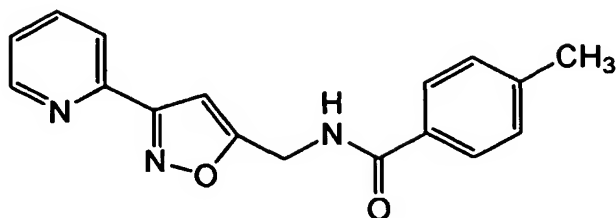
実施例18(30)：N-{[3-(2-メチル-1-プロペニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号III-216)：



融点：74～85℃。

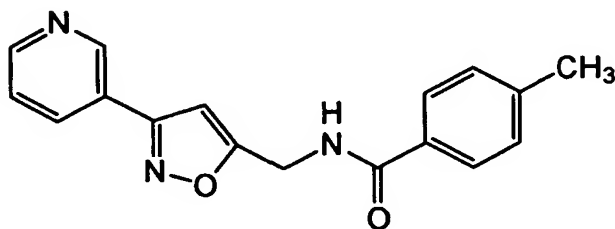
実施例18(31)：N-{[3-(2-ピリジル)-5-イソオキサゾリル]

ル] メチル} - 4 - メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-217) :



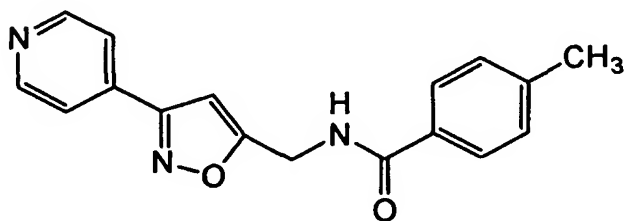
融点 : 141 ~ 142 °C。

- 5 実施例18 (32) : N-{[3-(3-ピリジル) - 5-イソオキサゾリル] メチル} - 4 - メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-218) :



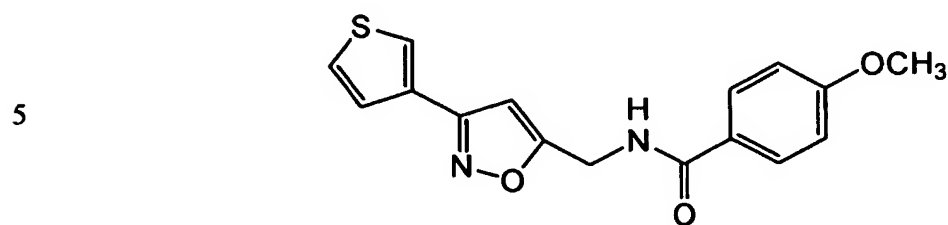
融点 : 127 ~ 129 °C。

- 10 実施例18 (33) : N-{[3-(4-ピリジル) - 5-イソオキサゾリル] メチル} - 4 - メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-219) :



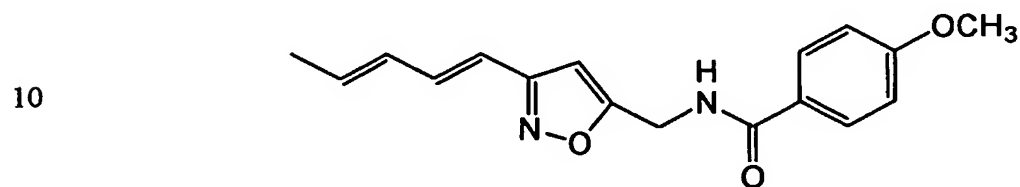
NMR : δ 2.40(3H, s), 4.82(2H, d), 6.62(1H, s), 6.98(1H, br), 7.13-8.88(8H, m)。

実施例 18 (34) : N- { [3- (3-チエニル) -5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-220) :



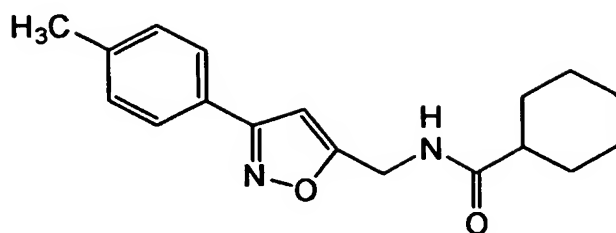
融点 : 142 ~ 155°C。

実施例 18 (35) : N- { [3- (1, 3-ペンタジエニル) -5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-221) :



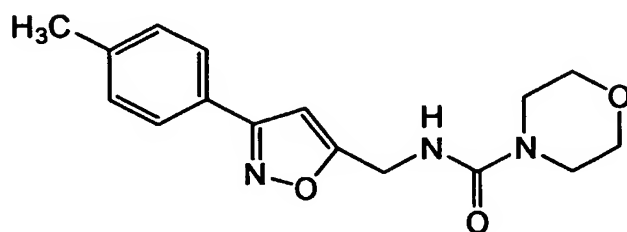
融点 : 151 ~ 154°C。

実施例 18 (36) : N- { [3- (4-トリル) -5-イソオキサゾリル] メチル } シクロヘキサンカーボキサミドの製造 (化合物番号 III-222) :



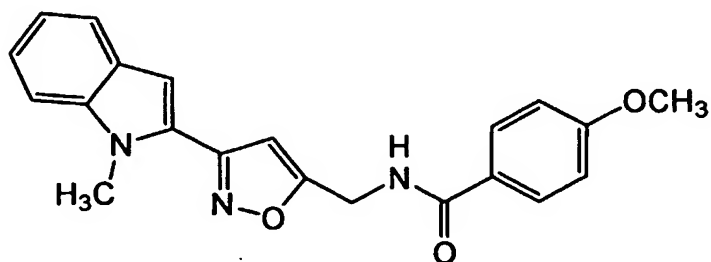
融点：162～164℃。

実施例18(37)：N-{[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-モルホリンカーボキサミドの製造(化合物番号Ⅲ-204)：



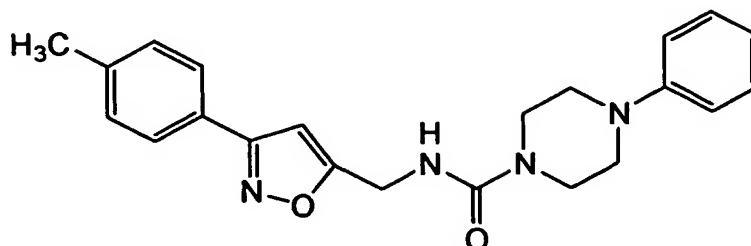
融点：118～123℃。

実施例18(38)：N-{[3-(1-メチルインドール-2-イル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号Ⅲ-223)：



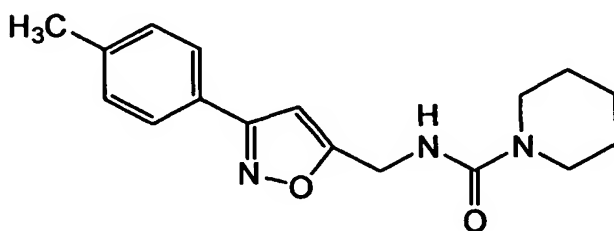
融点：110～114℃。

実施例 18 (39) : N- { [3- (4-トリル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-フェニルピペラジン-1-カーボキサミドの製造 (化合物番号 III-207) :



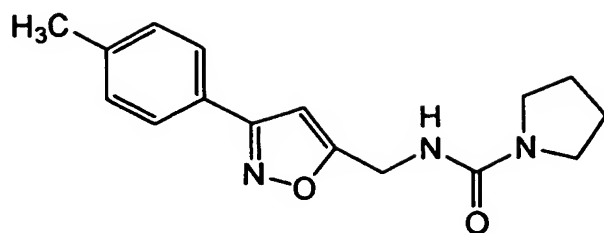
5 融点 : 177 ~ 179°C。

実施例 18 (40) : N- { [3- (4-トリル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -1-ピペリジンカーボキサミドの製造 (化合物番号 III-203) :



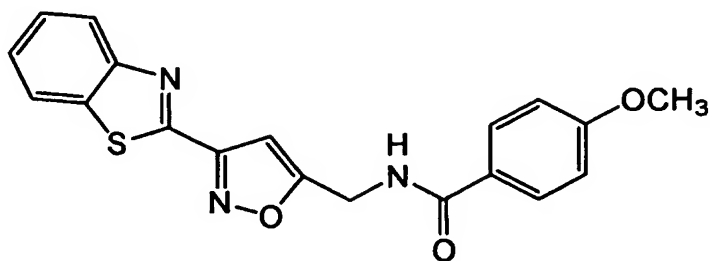
10 融点 : 130 ~ 133°C。

実施例 18 (41) : N- { [3- (4-トリル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -1-ピロリジンカーボキサミドの製造 (化合物番号 III-205) :



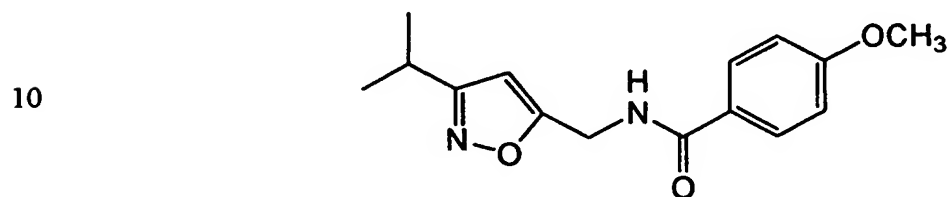
融点：131～142℃。

実施例18(42)：N-〔3-(ベンゾ[d]チアゾール-2-イル)-5-イソキサゾリル〕メチル〕-4-メトキシ安息香酸アミドの製造
5 (化合物番号III-224)：



NMR： δ 3.85(3H, s), 4.74(2H, d), 6.72(1H, s), 6.69-8.34(4H, m), 9.42(1H, br)。

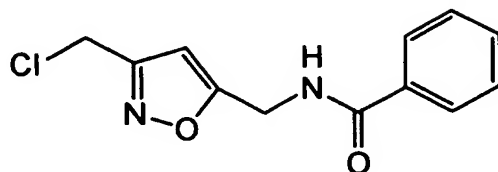
実施例18(43)：N-〔(3-イソプロピル-5-イソキサゾリル)メチル〕-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号III-225)：



融点：114～119℃。

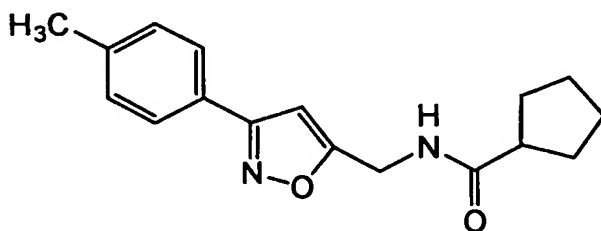
実施例18(44)：N-〔(3-クロロメチル-5-イソキサゾリル)

メチル] 安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-226) :



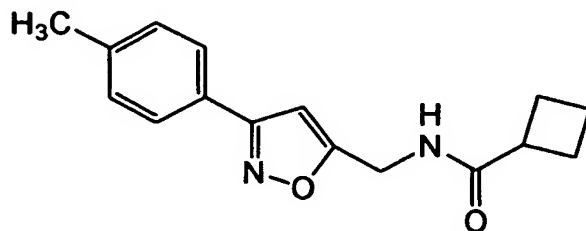
融点: 109~117℃。

5 実施例 18 (45) : N- { [3- (4-トリル) -5-イソオキサゾリ
ル] メチル} シクロペンタンカーボキサミドの製造 (化合物番号 III-22
7) :



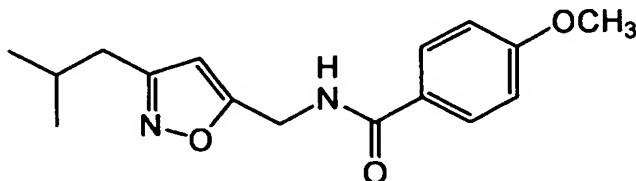
融点: 162~164℃。

10 実施例 18 (46) : N- { [3- (4-トリル) -5-イソオキサゾリ
ル] メチル} シクロブタンカーボキサミドの製造 (化合物番号 III-22
8) :



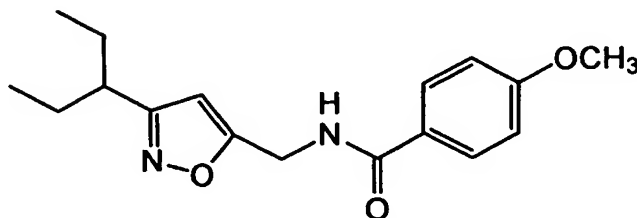
融点: 168~170℃。

実施例 18 (47) : N- [(3-イソブチル-5-イソオキサゾリル) メチル] -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-229) :



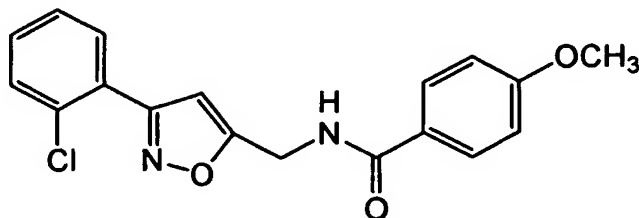
融点 : 94 ~ 113℃。

- 5 実施例 18 (48) : N- { [3- (1-エチルプロピル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-230) :



融点 : 95 ~ 114℃。

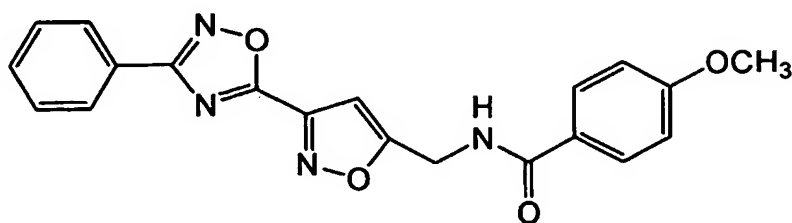
- 10 実施例 18 (49) : N- { [3- (2-クロロフェニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-231) :



融点：87～101℃。

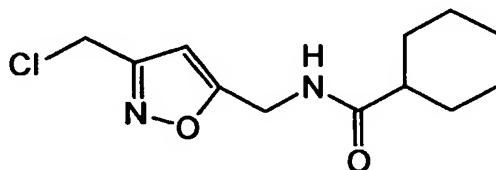
実施例18(50)：N-〔〔3-(3-フェニル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号III-232)：

5



融点：150～162℃。

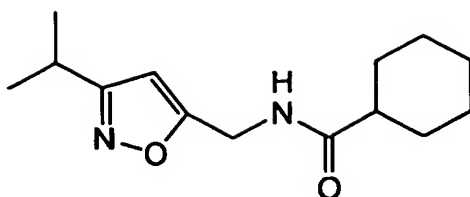
実施例18(51)：N-〔(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル〕シクロヘキサンカーボキサミドの製造(化合物番号III-233)：



10 性状：ペースト，

NMR： δ 1.03-2.33(11H, m), 4.52(2H, s), 4.52(2H, d), 6.03(1H, br), 6.26(1H, s)。

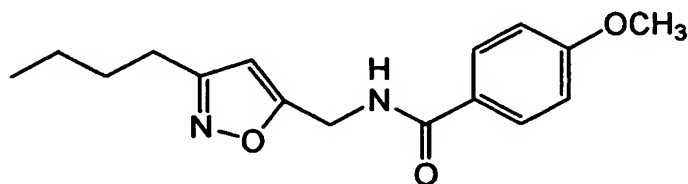
実施例18(52)：N-〔(3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル)メチル〕シクロヘキサンカーボキサミドの製造(化合物番号III-234)：



性状：油状，

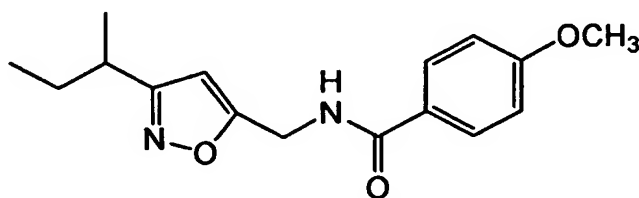
NMR： δ 0.87-2.27(10H, m), 1.20(3H, s), 1.30(3H, s), 2.82-3.23(1H, m), 4.50(2H, d), 5.92(1H, br), 6.00(1H, s)。

- 5 実施例 18 (53)：N-[(3-ブチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-235)：



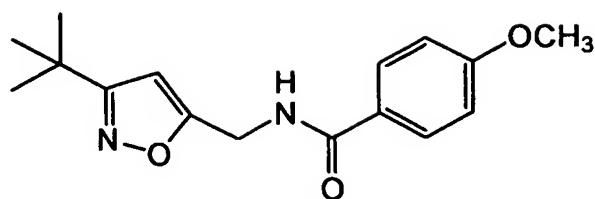
融点：101～104℃。

- 10 実施例 18 (54)：N-[(3-sec-ブチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-236)：



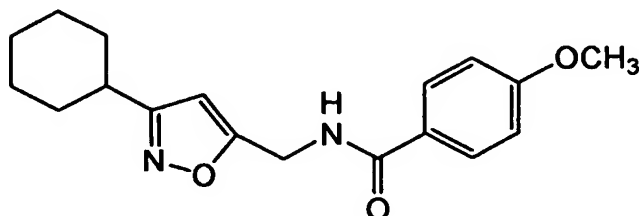
融点：70～80℃。

- 実施例 18 (55)：N-[(3-tert-ブチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-237)：



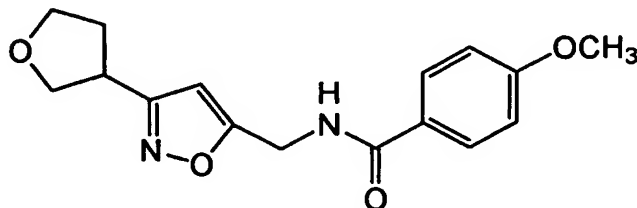
融点：125～132℃。

実施例18(56)：N-[(3-シクロヘキシル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号Ⅲ-238)：



融点：93～107℃。

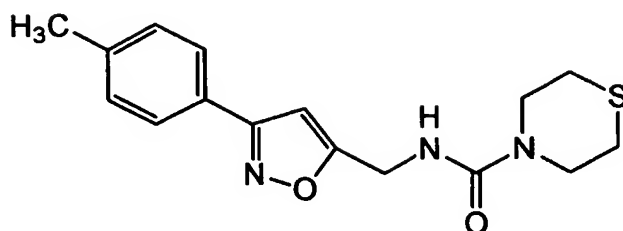
実施例18(57)：N-{[3-(オキシラン-3-イル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号Ⅲ-239)：



融点：113～117℃。

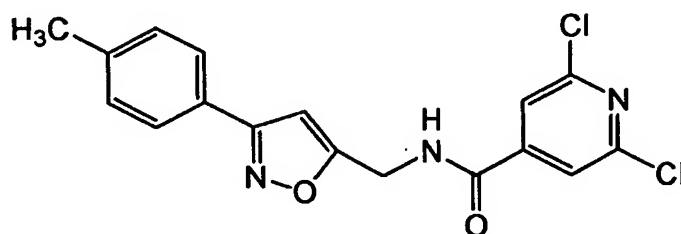
実施例18(58)：N-{[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]

ル] メチル} - 1, 4-チアジナシ-4-カーボキサミドの製造 (化合物番号 III-206) :



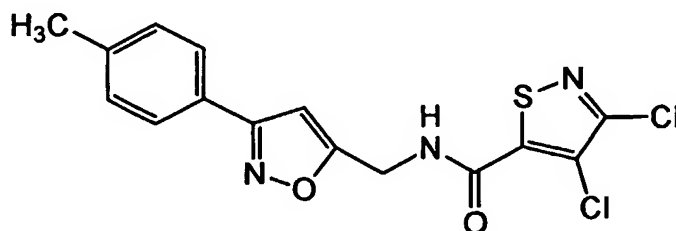
融点 : 141 ~ 145 °C。

- 5 実施例 18 (59) : N-{[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-2,6-ジクロロピリジン-4-カーボキサミドの製造 (化合物番号 III-240) :



融点 : 149 ~ 151 °C。

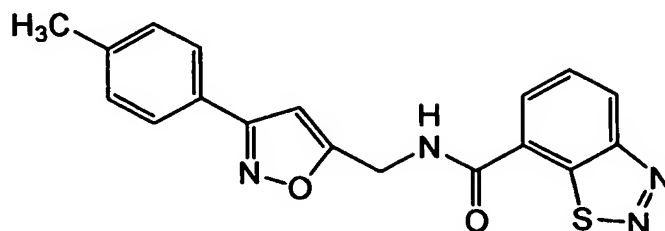
- 10 実施例 18 (60) : N-{[3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-3,4-ジクロロイソチアゾール-5-カーボキサミドの製造 (化合物番号 III-241) :



融点：155～157℃。

実施例18(61)：N-〔〔3-(4-トリル)-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-ベンゾ[d][1,2,3]チアジアゾール-7-カーボキサミドの製造(化合物番号III-242)：

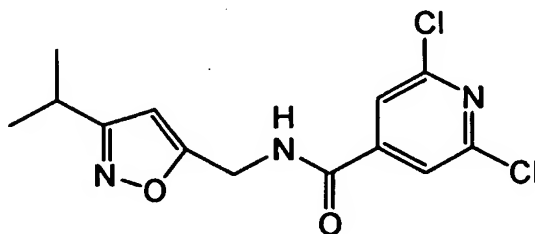
5



融点：178～192℃。

実施例18(62)：N-〔〔3-イソプロピル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-2,6-ジクロロピリジン-4-カーボキサミドの製造(化合物番号III-243)：

10

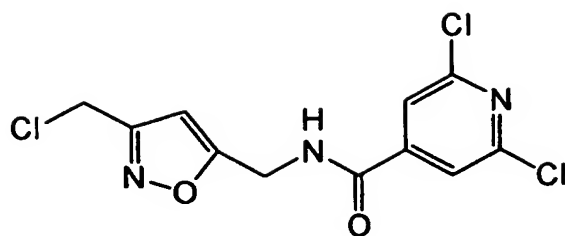


性状：油状，

NMR： δ 1.19(3H, s), 1.28(3H, s), 2.73-3.22(1H, m), 4.70(2H, d), 6.13(1H, s), 7.68(2H, s), 8.00(1H, br)。

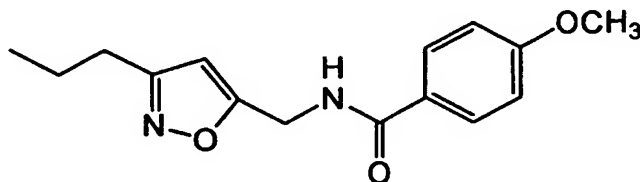
15 実施例18(63)：N-〔〔3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-2,6-ジクロロピリジン-4-カーボキサミドの製造(化合物

番号 III-244) :



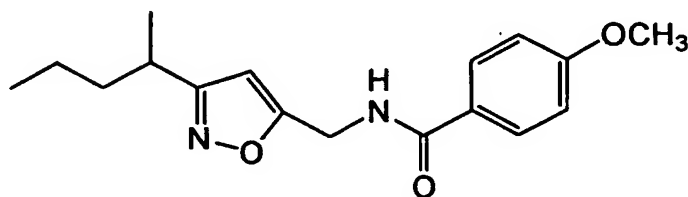
NMR : δ 4.54(2H, s), 4.73(2H, d), 6.34(1H, s), 6.81(1H, br), 7.59(2H, s)。

実施例 18 (64) : N-[(3-プロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]
5 ル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-245) :



融点 : 97 ~ 102℃。

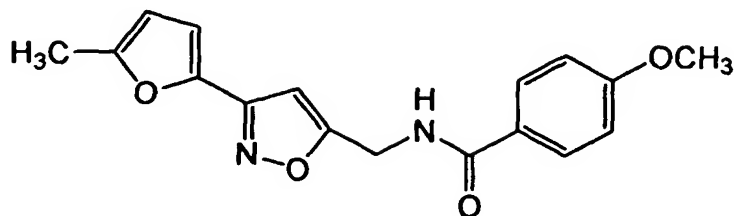
実施例 18 (65) : N-[(3-sec-ペンチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-24
10 6) :



融点 : 72 ~ 76℃。

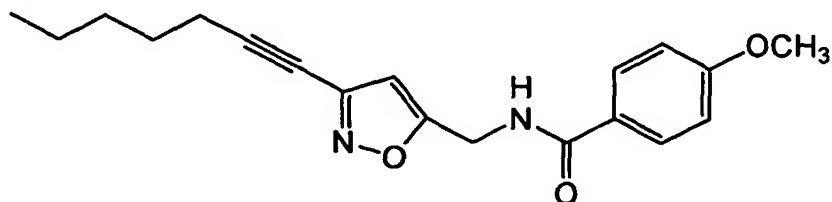
実施例 18 (66) : N-{[3-(2-メチルフラン-5-イル)-5-

イソオキサゾリル] メチル] - 4 - メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-247) :



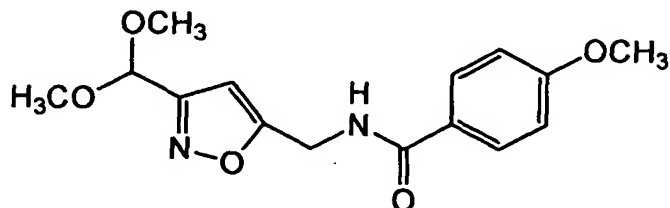
融点 : 107 ~ 109℃。

- 5 実施例 18 (67) : N - { [3 - (1 - ヘプチニル) - 5 - イソオキサゾリル] メチル } - 4 - メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-248) :



融点 : 96 ~ 102℃。

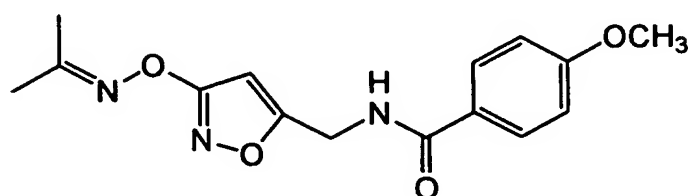
- 10 実施例 18 (68) : N - [(3 - ジメトキシメチル - 5 - イソオキサゾリル) メチル] - 4 - メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-249) :



性状 : ペースト,

NMR : δ 3.36(6H, s), 3.83(3H, s), 4.73(2H, d), 5.40(1H, s), 6.28(1H, s), 6.73(1H, br), 6.88(2H, d), 7.74(2H, d)。

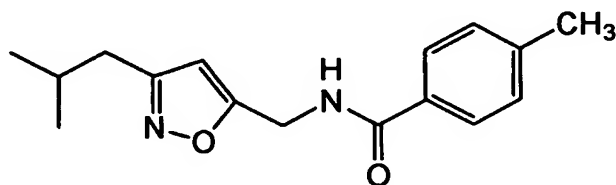
- 実施例 18 (69) : N-[(3-イソプロピルイミノオキシ-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-250) :



性状 : ペースト,

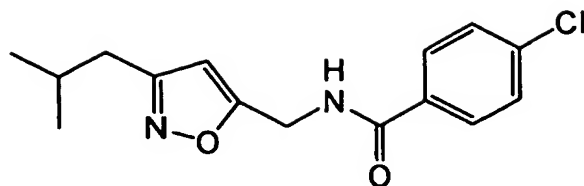
NMR : δ 1.81(6H, s), 3.83(3H, s), 4.68(2H, d), 5.02(2H, s), 6.22(1H, s), 6.86(2H, d), 7.74(2H, d)。

- 10 実施例 18 (70) : N-[(3-イソブチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-251) :



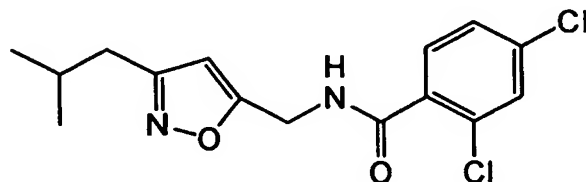
融点 : 131 ~ 134°C。

- 15 実施例 18 (71) : N-[(3-イソブチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-クロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-252) :



融点：122～124℃。

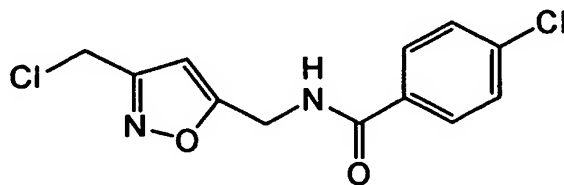
- 実施例18(72)：N-[(3-イソブチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2,4-ジクロロ安息香酸アミドの製造（化合物番号 III-253）：



性状：油状，

NMR： δ 0.88(3H, s), 0.96(3H, s), 1.76-2.13(1H, m), 2.51(2H, d), 4.71(2H, d), 6.09(1H, s), 6.84(1H, br), 7.16-7.70(3H, m)。

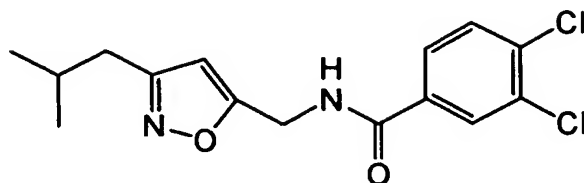
- 10 実施例18(73)：N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-クロロ安息香酸アミドの製造（化合物番号 III-254）：



融点：145～147℃。

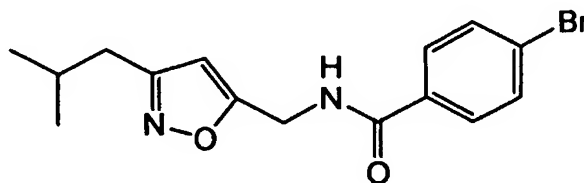
実施例18(74)：N-[(3-イソブチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2,4-ジクロロ安息香酸アミドの製造（化合物番号 III-255）：

チル] - 3, 4-ジクロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-255) :



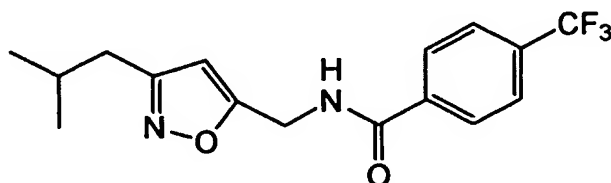
融点: 68 ~ 74 °C。

5 実施例 18 (75) : N-[(3-イソブチル-5-イソオキサゾリル)メチル] - 4-ブロモ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-256) :



融点: 124 ~ 125 °C。

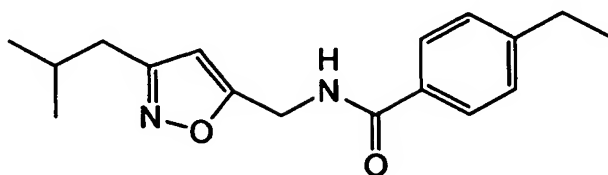
10 実施例 18 (76) : N-[(3-イソブチル-5-イソオキサゾリル)メチル] - 4-トリフルオロメチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-257) :



融点: 111 ~ 112 °C。

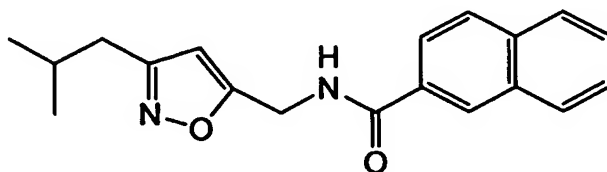
実施例 18 (77) : N-[(3-イソブチル-5-イソオキサゾリル)メ

チル] - 4 - エチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III - 258) :



融点 : 127 ~ 128 °C。

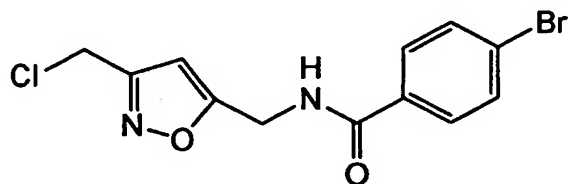
実施例 18 (78) : N - [(3 - イソブチル - 5 - イソオキサゾリル) メ
5 チル] - 2 - ナフタレンカーボキサミドの製造 (化合物番号 III - 259) :



融点 : 109 ~ 118 °C。

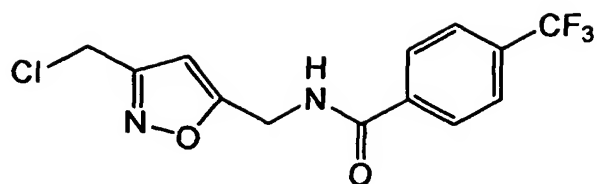
実施例 18 (79) : N - [(3 - クロロメチル - 5 - イソオキサゾリル) メチル] - 4 - ブロモ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III - 260) :

10



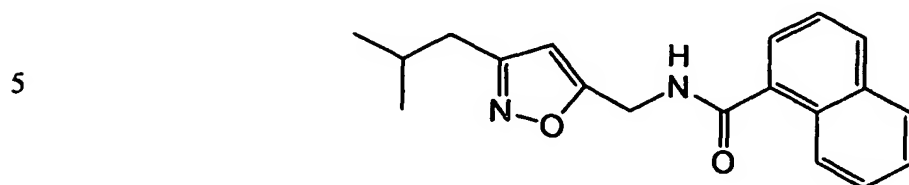
NMR : δ 4.55(2H, s), 4.70(2H, d), 6.35(1H, s), 7.64(4H, d), 7.97(1H, br)。

実施例 18 (80) : N - [(3 - クロロメチル - 5 - イソオキサゾリル) メチル] - 4 - トリフルオロメチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III -
261) :



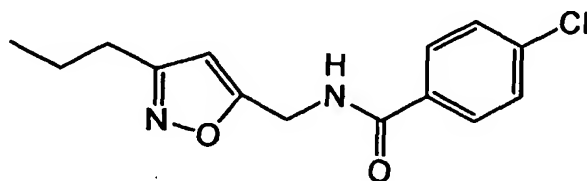
融点：145～147℃。

実施例18(81)：N-[(3-イソブチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-ナフタレンカーボキサミドの製造(化合物番号III-262)：



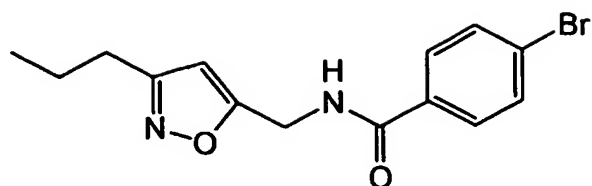
融点：89～92℃。

実施例18(82)：N-[(3-プロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-クロロ安息香酸アミドの製造(化合物番号III-263)：



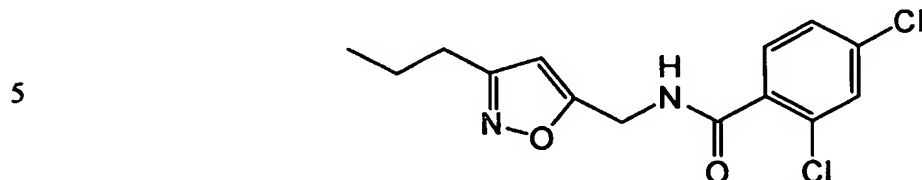
10 融点：133～134℃。

実施例18(83)：N-[(3-プロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-ブロモ安息香酸アミドの製造(化合物番号III-264)：



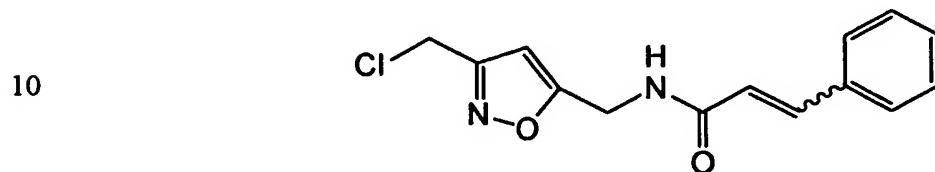
融点：132～133℃。

実施例18(84)：N-[(3-プロピル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2,4-ジクロロ安息香酸アミドの製造(化合物番号III-265)：



融点：67～71℃。

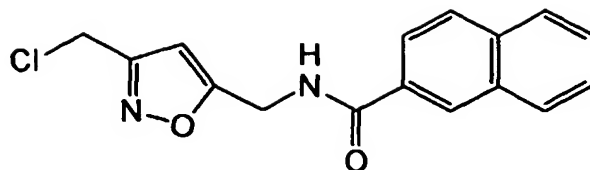
実施例18(85)：N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-β-フェニルアクリル酸アミドの製造(化合物番号III-266)：



NMR：δ 4.52(2H, s), 4.67(2H, d), 6.30(1H, s), 6.35(0.5H, s), 6.52(0.5H, s), 6.80(1H, br), 7.13-7.75(6H, m)。

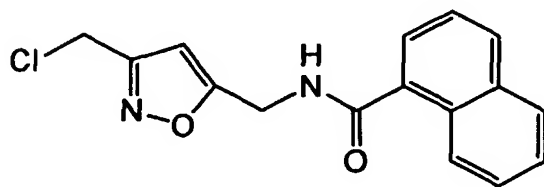
実施例18(86)：N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-ナフタレンカーボキサミドの製造(化合物番号III-266)

7) :



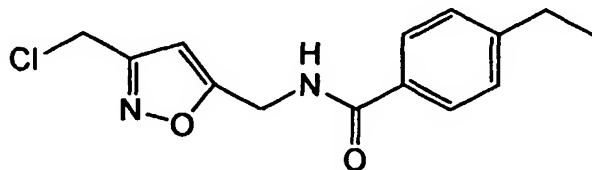
融点 : 106 ~ 119℃。

実施例 18 (87) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-1-ナフタレンカーボキサミドの製造 (化合物番号 III-268) :



融点 : 120 ~ 123℃。

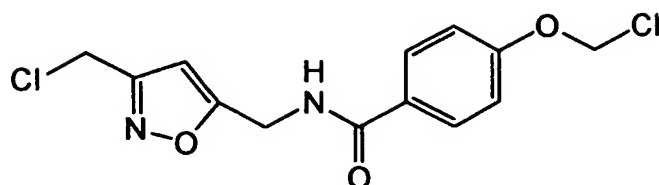
実施例 18 (88) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-エチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-269) :



NMR : δ 1.22(3H, t), 2.65(2H, q), 4.51(2H, s), 4.72(2H, d), 6.31(1H, s), 6.72(1H, br), 7.20(2H, d), 7.71(2H, d)。

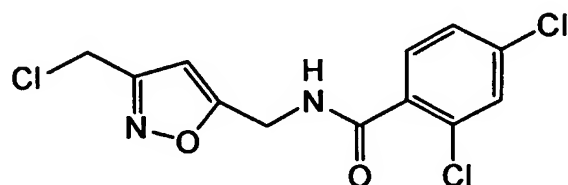
実施例 18 (89) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)

メチル] - 4 - クロロメチルオキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III - 270) :



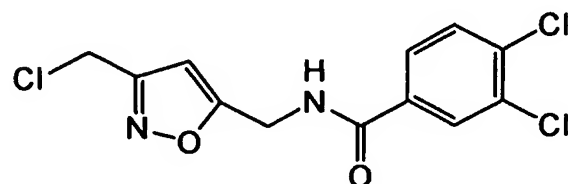
融点 : 85 ~ 88℃。

- 5 実施例 18 (90) : N - [(3 - クロロメチル - 5 - イソオキサゾリル) メチル] - 2, 4 - ジクロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III - 271) :



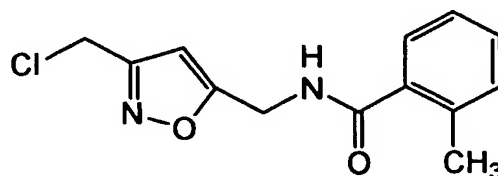
融点 : 90 ~ 91℃。

- 10 実施例 18 (91) : N - [(3 - クロロメチル - 5 - イソオキサゾリル) メチル] - 3, 4 - ジクロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III - 272) :



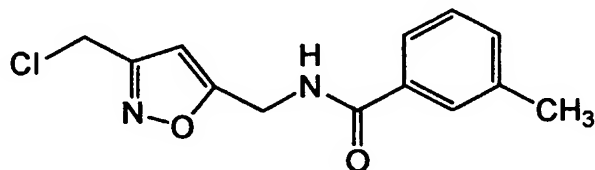
融点 : 119 ~ 121℃。

実施例 18 (92) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-273) :



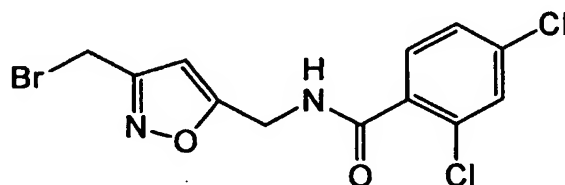
融点 : 76 ~ 83℃。

5 実施例 18 (93) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-274) :



融点 : 87 ~ 93℃。

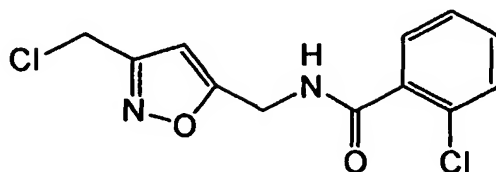
10 実施例 18 (94) : N-[(3-ブロモメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2,4-ジクロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-275) :



融点 : 108 ~ 109℃。

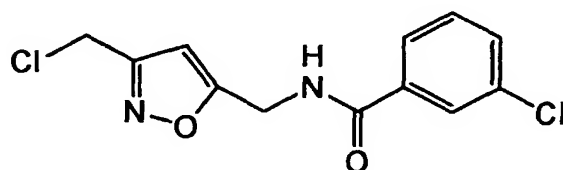
実施例 18 (95) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)

メチル] - 2 - クロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III - 276) :



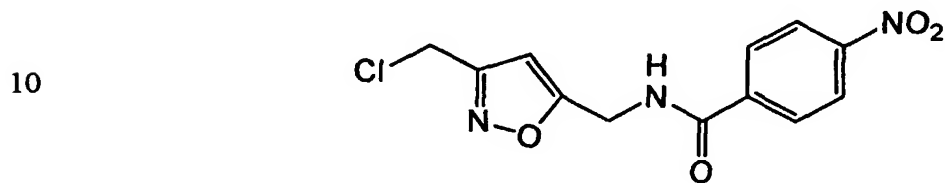
融点 : 108 ~ 109℃。

実施例 18 (96) : N - [(3 - クロロメチル - 5 - イソオキサゾリル)
5 メチル] - 3 - クロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III - 277) :



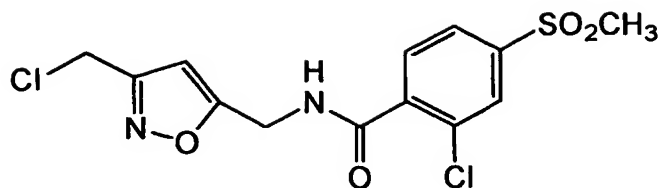
融点 : 102 ~ 104℃。

実施例 18 (97) : N - [(3 - クロロメチル - 5 - イソオキサゾリル)
メチル] - 4 - ニトロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III - 278) :



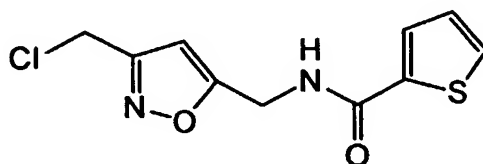
融点 : 125 ~ 128℃。

実施例 18 (98) : N - [(3 - クロロメチル - 5 - イソオキサゾリル)
メチル] - 2 - クロロ - 4 - メタンスルホニル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III - 279) :



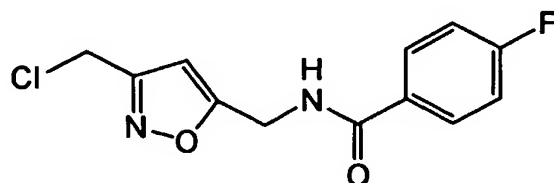
融点：107～110℃。

実施例18(99)：N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-チオフェンカーボキサミドの製造(化合物番号 III-28
5 0)：



融点：117～125℃。

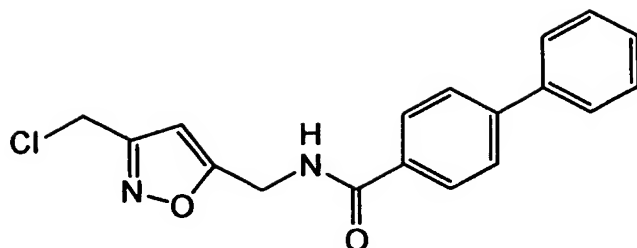
実施例18(100)：N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-フルオロ安息香酸アミドの製造(化合物番号 III-28
10 1)：



融点：116～120℃。

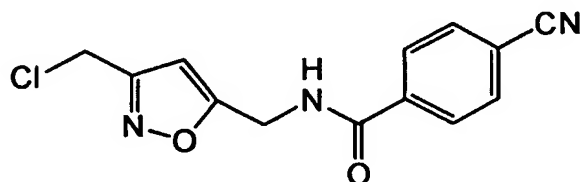
実施例18(101)：N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-フェニル安息香酸アミドの製造(化合物番号 III-28

2) :



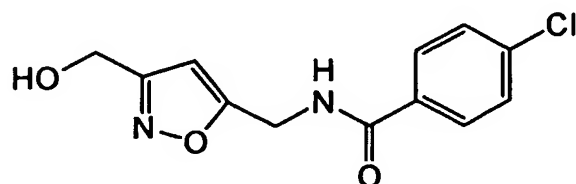
融点 : 129 ~ 139℃。

実施例 18 (102) : N-[(3-クロロメチルー5-イソオキサゾ
5 リル)メチル]-4-シアノ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-28
3) :



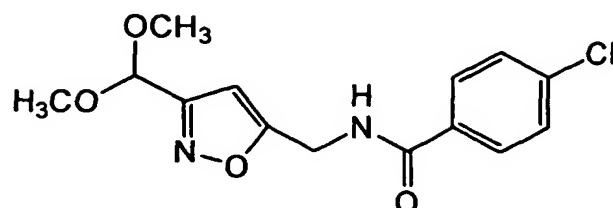
融点 : 124 ~ 126℃。

実施例 18 (103) : N-[(3-ヒドロキシメチルー5-イソオキサゾ
10 リル)メチル]-4-クロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-28
4) :



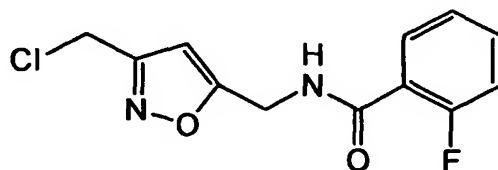
融点 : 135 ~ 139℃。

実施例 18 (104) : N-[(3-ジメトキシメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-クロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-285) :



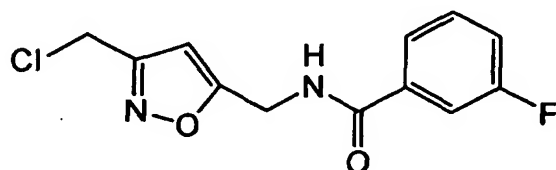
5 融点 : 84 ~ 86 °C。

実施例 18 (105) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-フルオロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-286) :



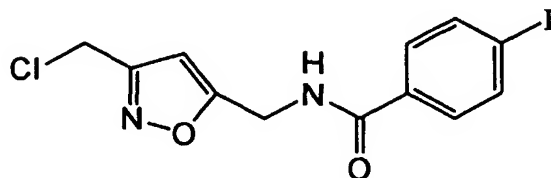
10 融点 : 95 ~ 97 °C。

実施例 18 (106) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3-フルオロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-287) :



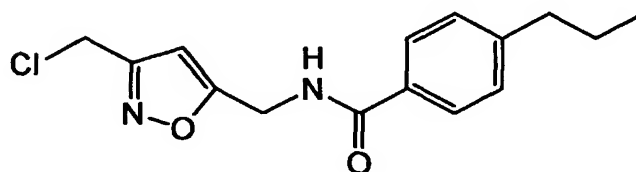
15 融点 : 117 ~ 118 °C。

実施例 18 (107) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-ヨード安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-288) :



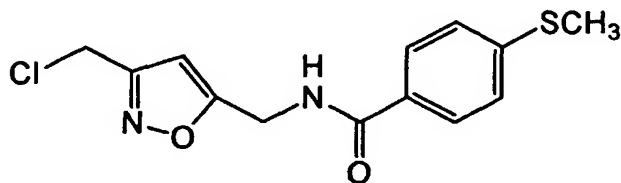
5 融点 : 169 ~ 172℃。

実施例 18 (108) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-プロピル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-289) :



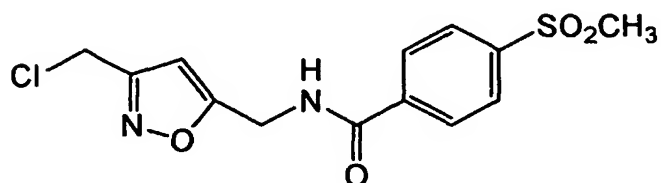
10 融点 : 110 ~ 113℃。

実施例 18 (109) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メチルチオ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-290) :



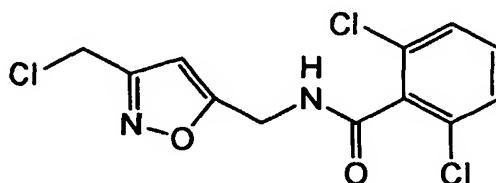
15 融点 : 147 ~ 149℃。

実施例 18 (110) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メタンスルホニル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-291) :



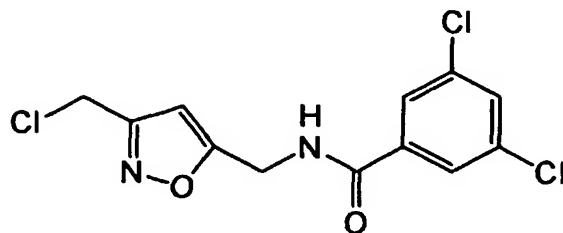
5 融点 : 134 ~ 135℃。

実施例 18 (111) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2,6-ジクロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-292) :



10 融点 : 94 ~ 95℃。

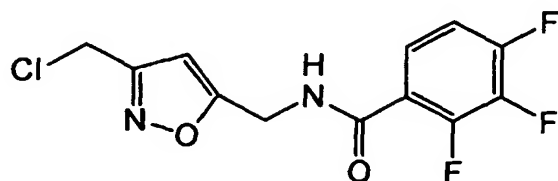
実施例 18 (112) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-3,5-ジクロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-293) :



融点：136～137℃。

実施例18(113)：N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2,3,4-トリフルオロ安息香酸アミドの製造(化合物番号III-294)：

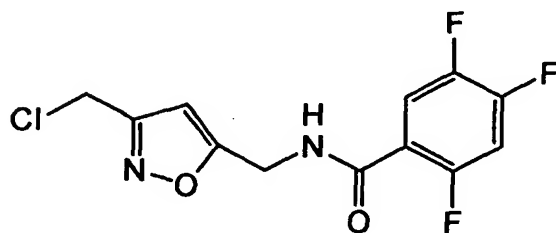
5



融点：105～106℃。

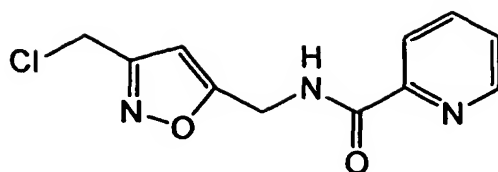
実施例18(114)：N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2,4,5-トリフルオロ安息香酸アミドの製造(化合物番号III-295)：

10



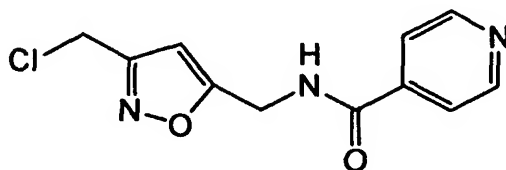
融点：116～118℃。

実施例18(115)：N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-ピリジンカーボキサミドの製造(化合物番号III-296)：



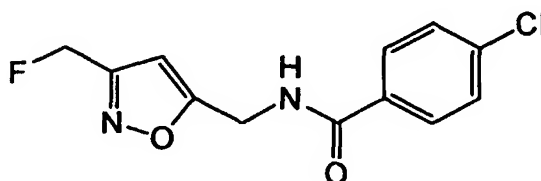
融点：132～134℃。

実施例18 (116) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリ
ル)メチル]-4-ピリジンカーボキサミドの製造 (化合物番号 III-29
5 7) :



融点：104～105℃。

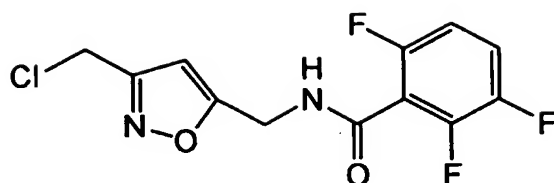
実施例18 (117) : N-[(3-フルオロメチル-5-イソオキサゾリ
ル)メチル]-4-クロロ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 III-29
10 8) :



融点：147～149℃。

実施例18 (118) : N-[(3-クロロメチル-5-イソオキサゾリ
ル)メチル]-2,3,6-トリフルオロ安息香酸アミドの製造 (化合物番

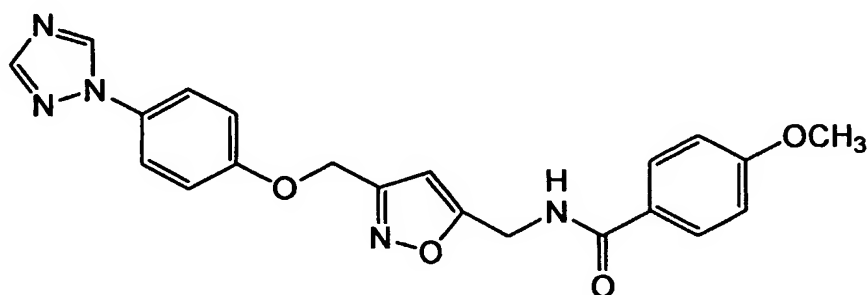
号 III-299) :



性状：油状,

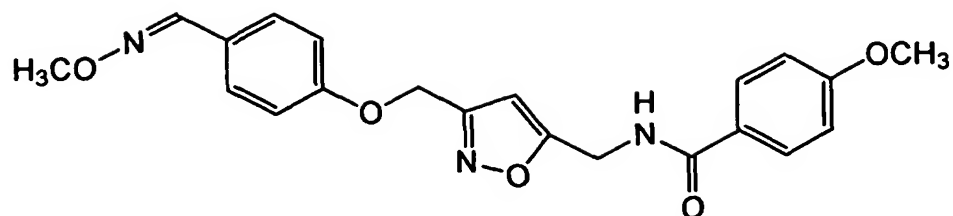
NMR : δ 4.50(2H,s), 4.60(2H,d), 6.25(1H,s), 6.60-7.00(1H,m), 7.00-7.20(1H,m),
 5 7.45-7.70(1H,brs)。

実施例 18 (119) : N- { [3- (1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) フェニルオキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-73) :



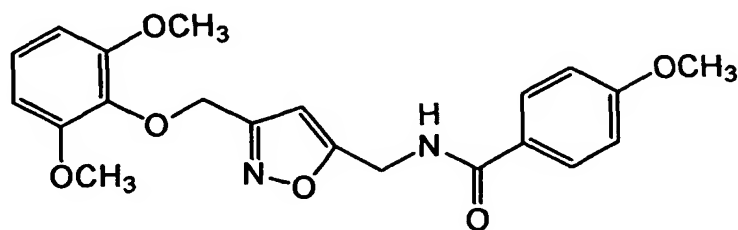
10 NMR : δ 3.87(3H, s), 4.72(2H, d), 5.17(2H, s), 6.35(1H, s), 6.80-8.50(10H, m),
 9.08(1H, s)。

実施例 18 (120) : N- { [3- (4-メトキシイミノメチルフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル } -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-75) :



融点：143～151℃。

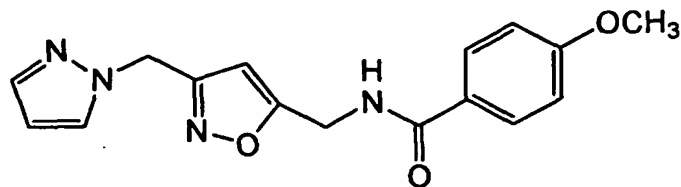
- 実施例18(121)：N-{[3-(2,6-ジメトキシフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミド
5 の製造（化合物番号IV-76）：



性状：ペースト，

NMR： δ 3.73(3H, s), 3.80(3H, s), 3.83(3H, s), 4.67(2H, d), 5.04(2H, s), 6.45(1H, s), 6.49-7.85(8H, m)。

- 10 実施例18(122)：N-{[3-(1,2-ジアゾール-1-イル)メチル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物番号IV-77）：

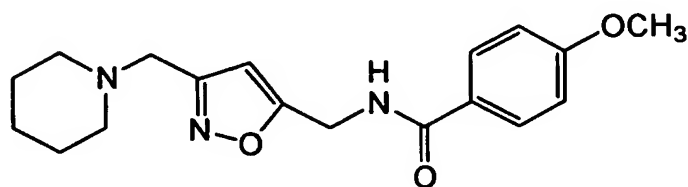


性状：ペースト，

NMR : δ 3.81(3H, s), 4.68(2H, s), 4.68(2H, d), 6.24(1H, s), 6.28(1H, br), 6.70(1H, br), 6.77-7.90(6H, m)。

実施例 18 (123) : N- { [3 - (1 - ピペリジル) メチルー 5 - イソ
オキサゾリル] メチル } - 4 - メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号

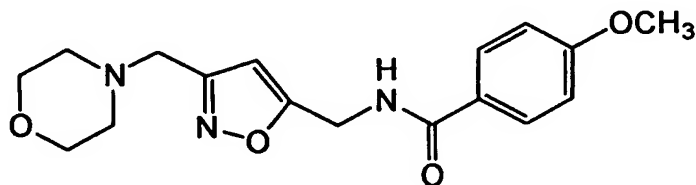
5 IV-24) :



性状 : 油状,

NMR : δ 3.51(2H, s), 3.84(3H, s), 4.73(2H, d), 6.27(1H, s), 6.73(1H, br), 6.91(2H, d), 7.77(2H, d)。

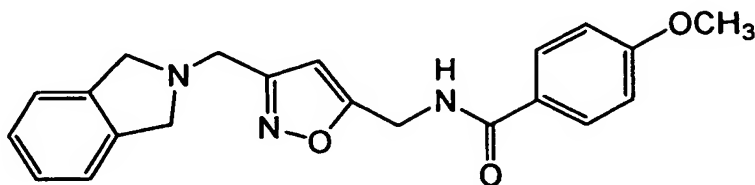
10 実施例 18 (124) : N- [(3 - モルホリノメチルー 5 - イソオキサゾ
リル) メチル] - 4 - メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-2
5) :



性状 : ペースト,

15 NMR : δ 2.32-2.52(4H, m), 3.52(2H, s), 3.56-3.73(4H, m), 3.83(3H, s), 4.68(2H, d), 6.21(1H, s), 6.87(2H, d), 7.30(1H, br), 7.80(1H, d)。

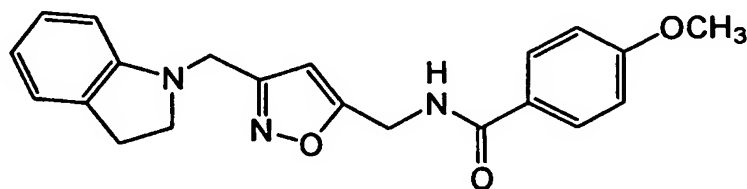
実施例 18 (125) : N- { [3- (1, 3-ジヒドロインドール-2-イル) メチル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-78) :



5 性状 : ペースト,

NMR : δ 3.84(3H, s), 3.92(2H, s), 3.98(4H, s), 4.72(2H, d), 6.28(1H, s), 6.56(1H, br), 6.90(2H, d), 7.14(4H, s), 7.73(2H, d)。

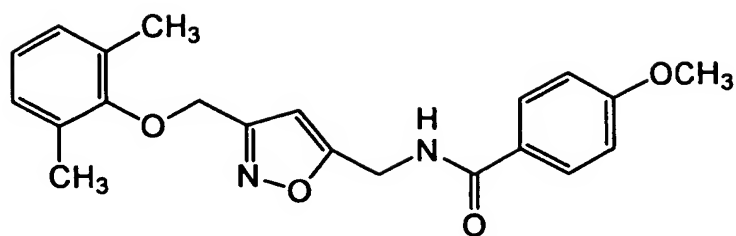
実施例 18 (126) : N- { [3- (2, 3-ジヒドロインドール-1-イル) メチル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-79) :



性状 : ペースト,

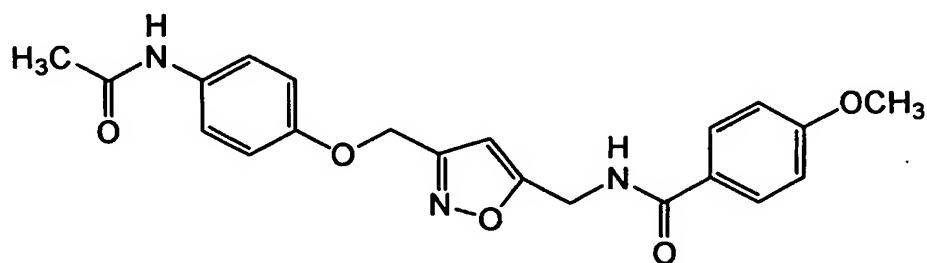
NMR : δ 2.80-3.28(2H, m), 3.80(3H, s), 3.72-4.28(2H, m), 4.68(2H, d), 5.28(2H, s), 6.30(1H, s), 6.72-7.87(9H, m)。

15 実施例 18 (127) : N- { [3- (2, 6-ジメチルフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-80) :



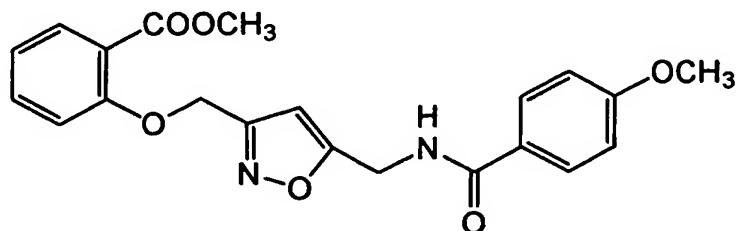
融点：139～146℃。

- 実施例18(128)：N-〔〔3-(4-アセチルアミノフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メトキシ安息香酸アミド
5 の製造(化合物番号IV-81)：



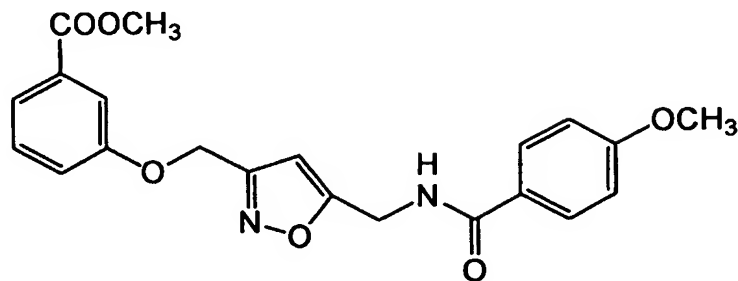
融点：183～188℃。

- 実施例18(129)：N-〔〔3-(2-メトキシカルボニルフェニル)オキシメチル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メトキシ安息香酸ア
10 ミドの製造(化合物番号IV-82)：



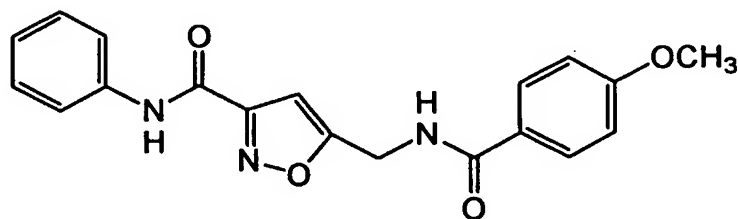
融点：85～88℃。

実施例 18 (130) : N- { [3- (3-メトキシカルボニルフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-83) :



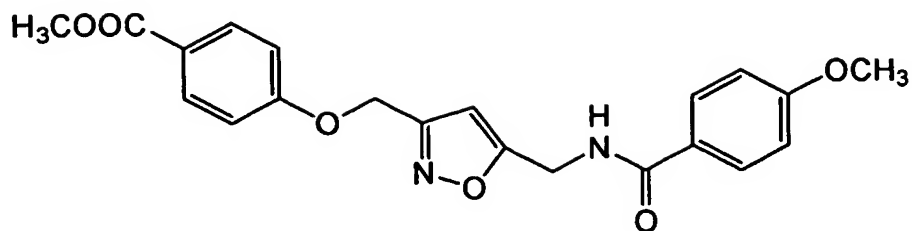
5 融点 : 106 ~ 112℃。

実施例 18 (131) : N- [(3-フェニルアミノカルボニル-5-イソオキサゾリル) メチル] -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-84) :



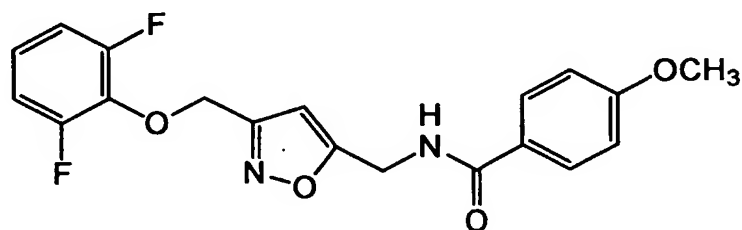
10 融点 : 186℃。

実施例 18 (132) : N- { [3- (4-メトキシカルボニルフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-85) :



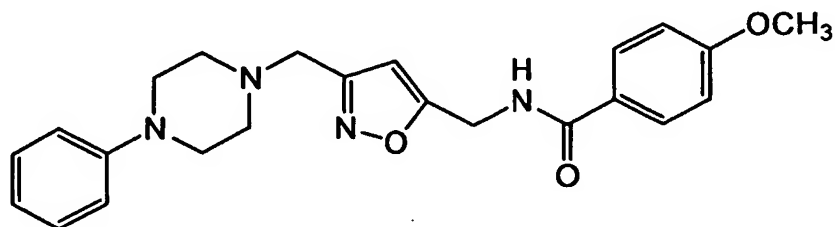
融点：155～162℃。

- 実施例18 (133) : N- { [3- (2, 6-ジフルオロフェニル) オキシメチルー5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミド
5 の製造 (化合物番号 IV-86) :



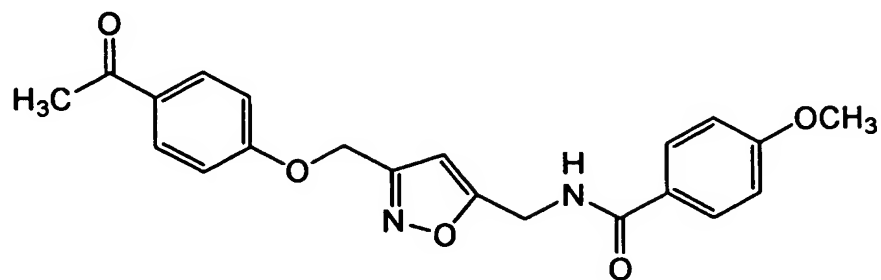
融点：111～116℃。

- 実施例18 (134) : N- { [3- (4-フェニルピペラジニル) メチルー5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造
10 (化合物番号 IV-28) :



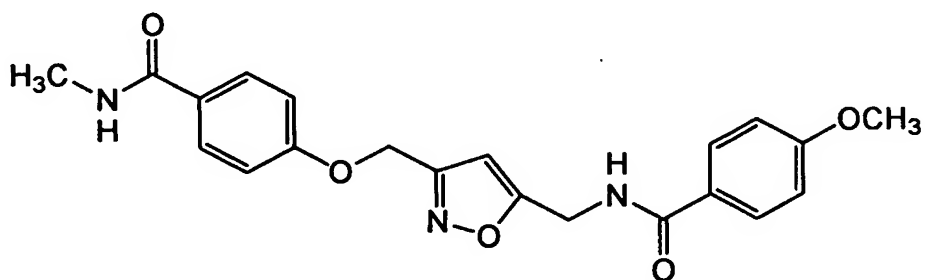
融点：148～158℃。

実施例 18 (135) : N- { [3- (4-アセチルフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-87) :



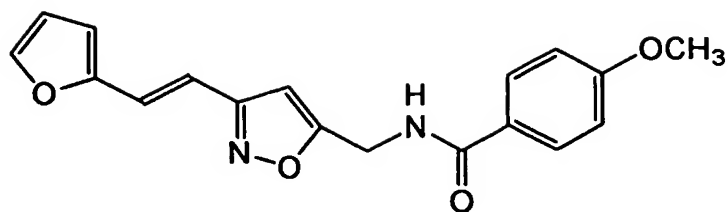
5 融点 : 148 ~ 156 °C。

実施例 18 (136) : N- { [3- (4-メチルアミノカルボニルフェニル) オキシメチル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-88) :



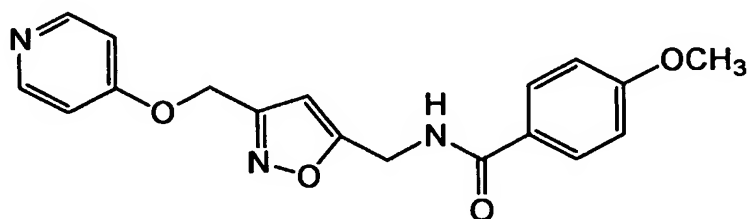
10 融点 : 211 ~ 214 °C。

実施例 18 (137) : N- { [3- (2- (2-フリル) エテニル) -5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-89) :



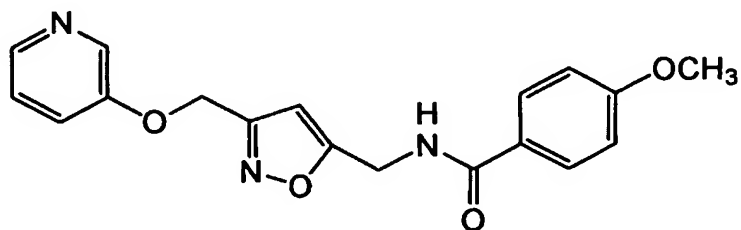
融点：159～164℃。

実施例18(138)：N-{[3-(4-ピリジル)オキシメチル-5-
イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物
5 番号IV-90）：



融点：154～159℃。

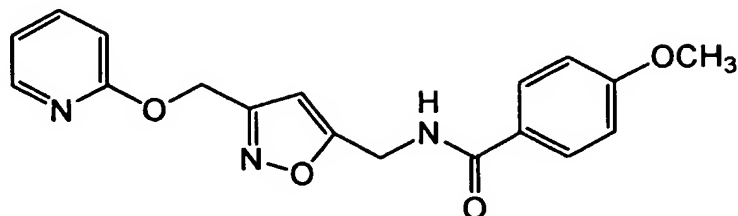
実施例18(139)：N-{[3-(3-ピリジル)オキシメチル-5-
イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造（化合物
10 番号IV-91）：



性状：油状，

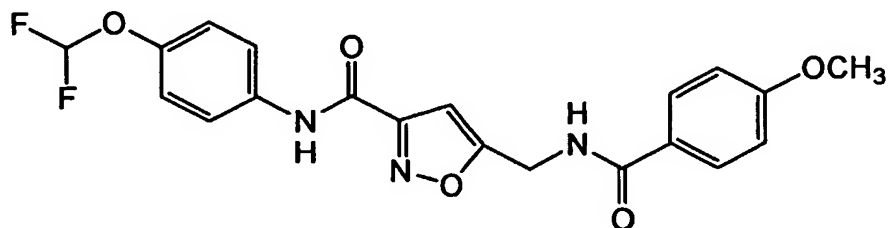
NMR： δ 3.78(3H, s), 4.66(2H, d), 5.08(2H, s), 6.32(1H, s), 6.70-8.35(9H, m)。

実施例 18 (140) : N- { [3- (2-ピリジル) オキシメチル- 5-
イソオキサゾリル] メチル} - 4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物
番号 IV-92) :



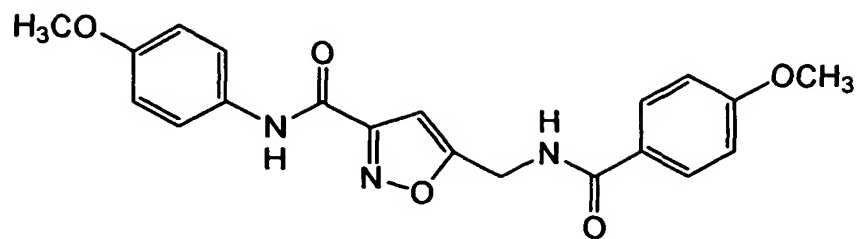
5 融点 : 169 ~ 172℃。

実施例 18 (141) : N- { [3- (4-ジフルオロメチルオキシフェニル)
アミノカルボニル- 5-イソオキサゾリル] メチル} - 4-メトキシ安
息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-93) :



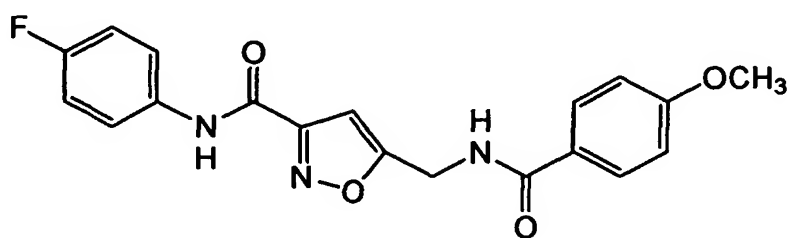
10 NMR : δ 3.85(3H, s), 4.76(2H, d), 6.60-8.00(9H, m), 8.30(1H, d), 9.30(1H, br)。

実施例 18 (142) : N- { [3- (4-メトキシフェニル) アミノカル
ボニル- 5-イソオキサゾリル] メチル} - 4-メトキシ安息香酸アミドの
製造 (化合物番号 IV-94) :



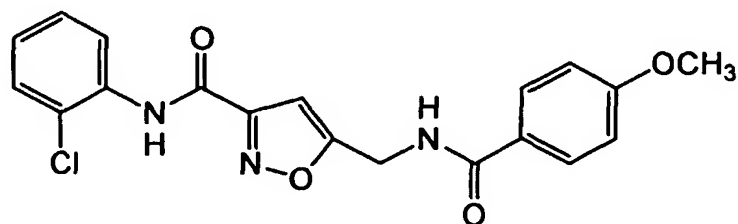
融点：186～188℃。

- 実施例18(143)：N-{[3-(4-フルオロフェニル)アミノカルボニル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-95)：



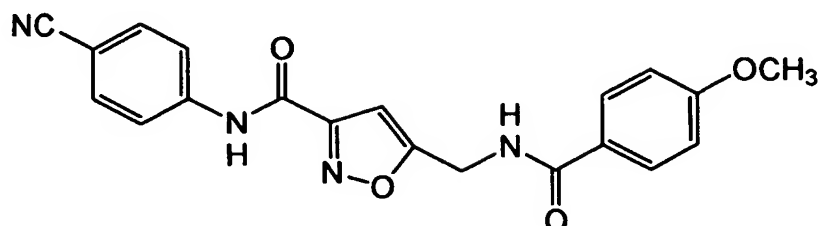
融点：191～193℃。

- 実施例18(144)：N-{[3-(2-クロロフェニル)アミノカルボニル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-96)：



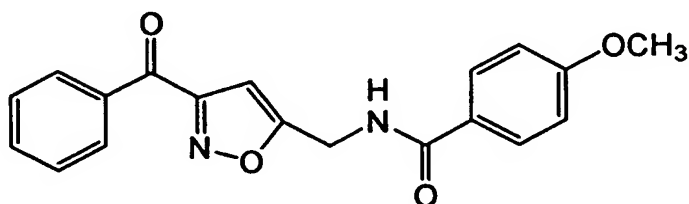
NMR： δ 3.83(3H, s), 4.76(2H, d), 6.60-8.00(9H, m), 8.20(1H, d), 9.10(1H, br)。

実施例 18 (145) : N- { [3- (4-シアノフェニル) アミノカルボニル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-97) :



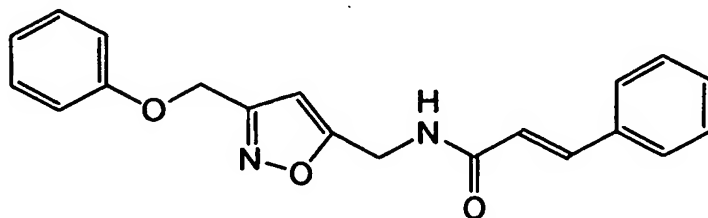
5 融点 : 138 ~ 140°C。

実施例 18 (146) : N- [(3-ベンゾイル-5-イソオキサゾリル) メチル] -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-98) :



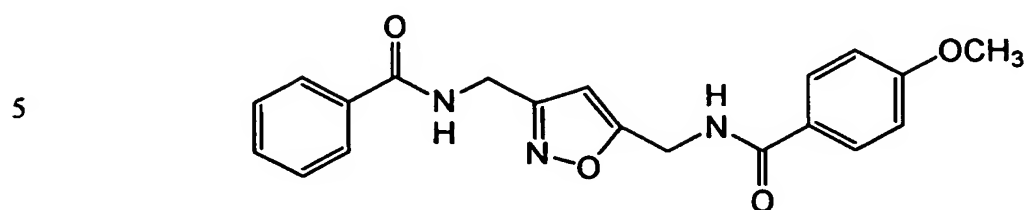
融点 : 118 ~ 127°C。

10 実施例 18 (147) : N- [(3-フェノキシメチル-5-イソオキサゾリル) メチル] -β-フェニルアクリル酸アミドの製造 (化合物番号 IV-99) :



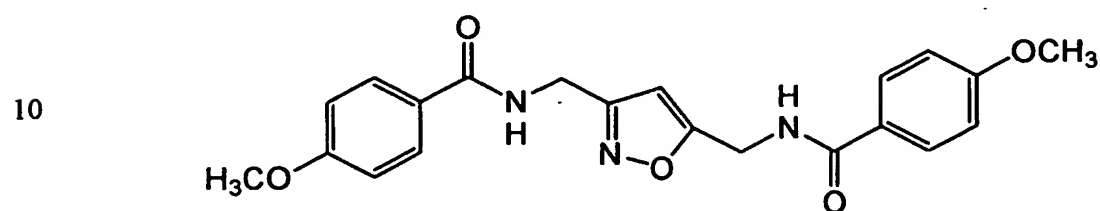
融点：110～116℃。

実施例18 (148) : N- [(3-ベンゾイルアミノメチル-5-イソオキサゾリル) メチル] -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-100) :



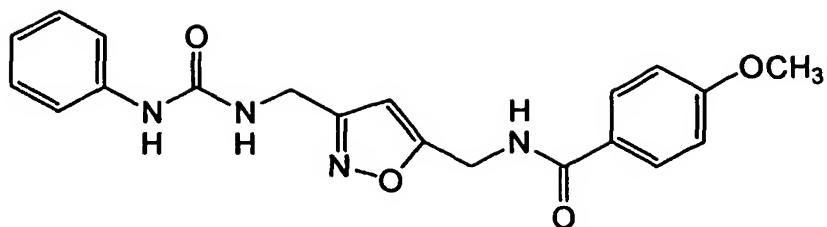
融点：118～124℃。

実施例18 (149) : N- { [3- (4-メトキシベンゾイル) アミノメチル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-101) :



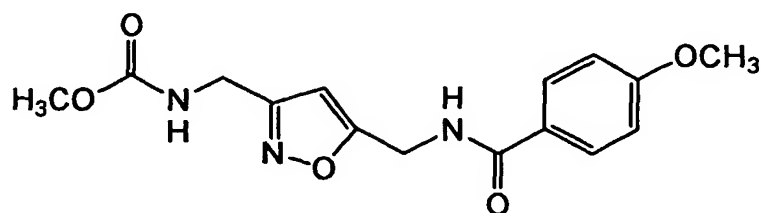
融点：176～179℃。

実施例18 (150) : N- [(3-フェニルアミノカルボニルアミノメチル-5-イソオキサゾリル) メチル] -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-102) :



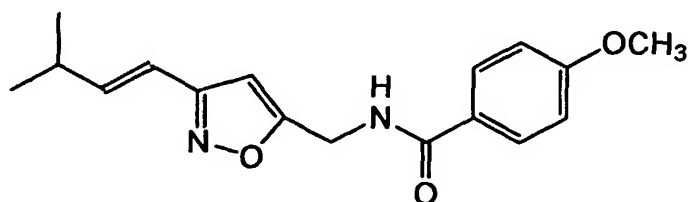
融点：169～178℃。

実施例18(151)：N-[(3-メトキシカルボニルアミノメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-103)：



融点：143～145℃。

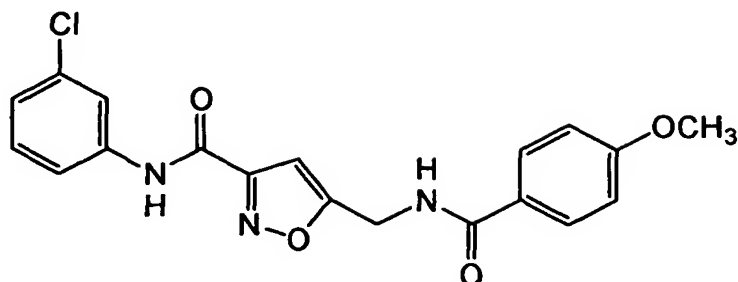
実施例18(152)：N-{[3-(4-メチル-1-ブテニル)-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-104)：



融点：104～113℃。

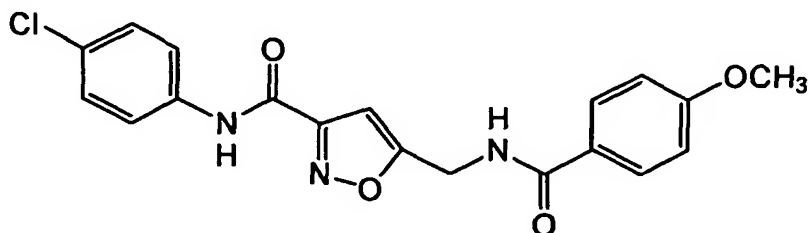
実施例18(153)：N-{[3-(3-クロロフェニル)アミノカルボ

ニル-5-イソオキサゾリル] メチル} -4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-105) :



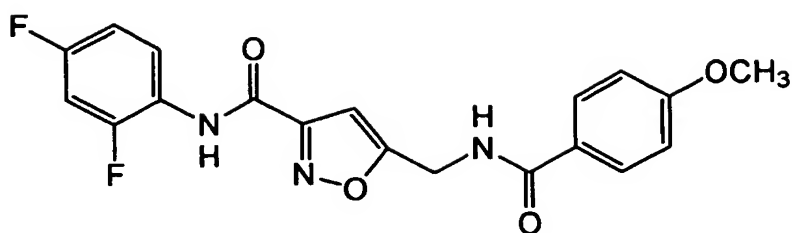
融点 : 164 ~ 166 °C。

- 5 実施例 18 (154) : N-{[3-(4-クロロフェニル)アミノカルボニル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-106) :



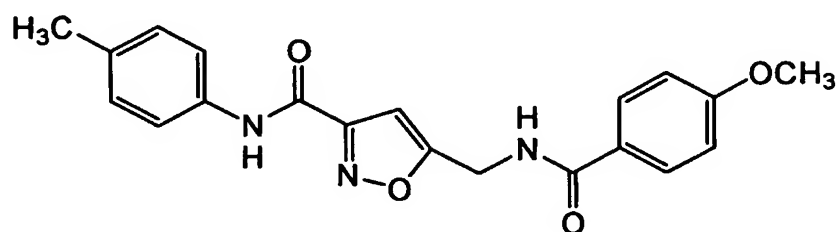
融点 : 185 ~ 186 °C。

- 10 実施例 18 (155) : N-{[3-(2,4-ジフルオロフェニル)アミノカルボニル-5-イソオキサゾリル]メチル}-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-107) :



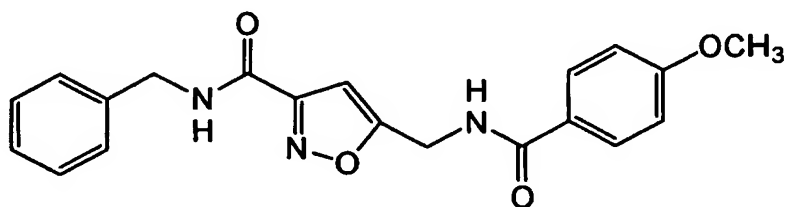
融点：165～167℃。

- 実施例18 (156) : N- { [3 - (4 - トリル) アミノカルボニル - 5 -
ーイソオキサゾリル] メチル } - 4 - メトキシ安息香酸アミドの製造 (化
5 合物番号 IV - 108) :



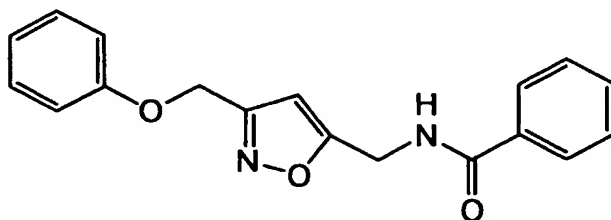
融点：174～176℃。

- 実施例18 (157) : N- [(3 - ベンジルアミノカルボニル - 5 - イソ
オキサゾリル) メチル] - 4 - メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号
10 IV - 109) :



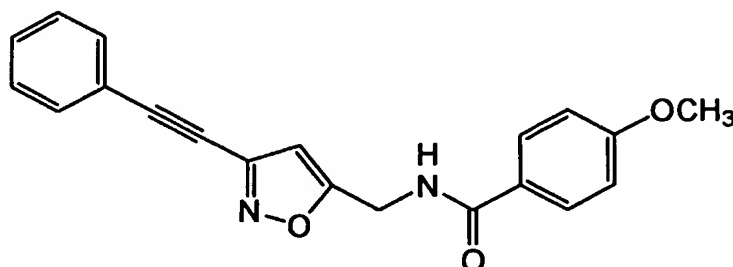
融点：171～172℃。

実施例 18 (158) : N-[(3-フェノキシメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-44) :



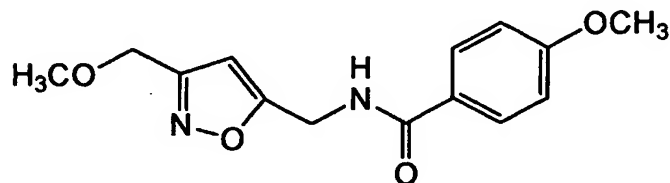
融点 : 85 ~ 87℃。

- 5 実施例 18 (159) : N-[(3-フェニルエチニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-110) :



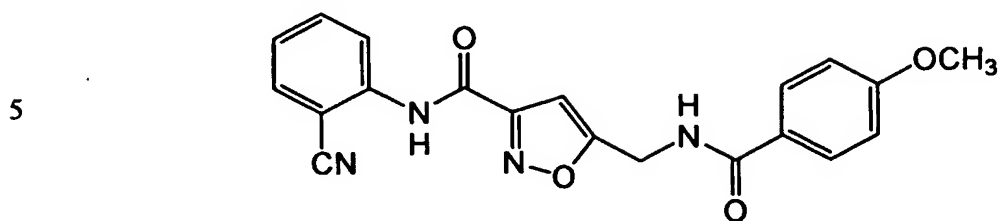
融点 : 88 ~ 101℃。

- 10 実施例 18 (160) : N-[(3-メトキシメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-111) :



融点：71～85℃。

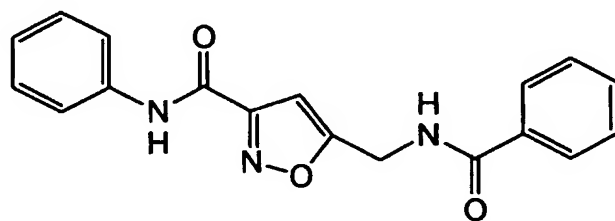
実施例18(161)：N-〔〔3-(2-シアノフェニル)アミノカルボニル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-メトキシ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-112)：



性状：ゴム状，

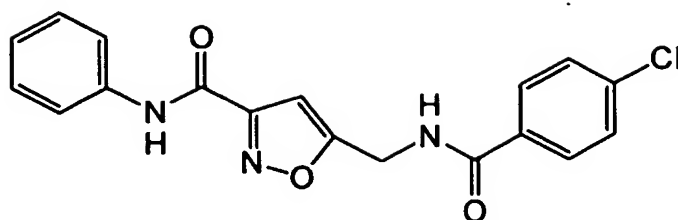
NMR： δ 3.86(3H, s), 4.75(2H, d), 6.40-8.00(10H, m), 8.20(1H, br), 9.40(1H, br)。

10 実施例18(162)：N-〔〔3-フェニルアミノカルボニル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-113)：



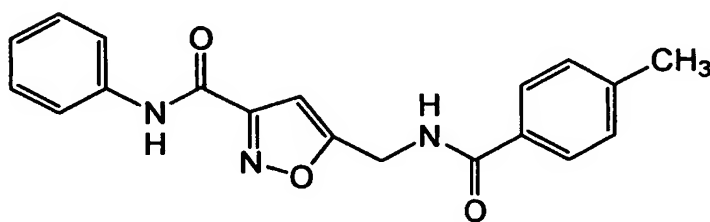
融点：177～178℃。

15 実施例18(163)：N-〔〔3-フェニルアミノカルボニル-5-イソオキサゾリル〕メチル〕-4-クロロ安息香酸アミドの製造(化合物番号IV-114)：



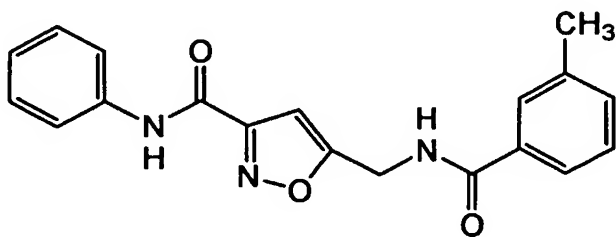
融点：200℃以上。

- 実施例18(164)：N-[(3-フェニルアミノカルボニル-5-イソ
オキサゾリル)メチル]-4-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号
5 IV-115）：



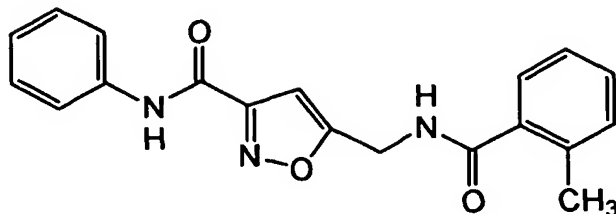
融点：193～195℃。

- 実施例18(165)：N-[(3-フェニルアミノカルボニル-5-イソ
オキサゾリル)メチル]-3-メチル安息香酸アミドの製造（化合物番号
10 IV-116）：



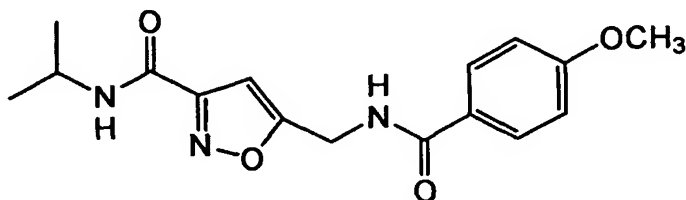
融点：151～152℃。

実施例 18 (166) : N-[(3-フェニルアミノカルボニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2-メチル安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-117) :



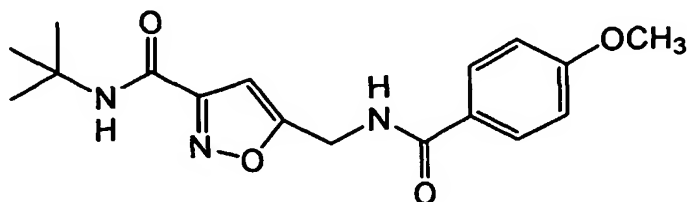
5 融点 : 162 ~ 163℃。

実施例 18 (167) : N-[(3-イソプロピルアミノカルボニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-118) :



10 融点 : 171 ~ 172℃。

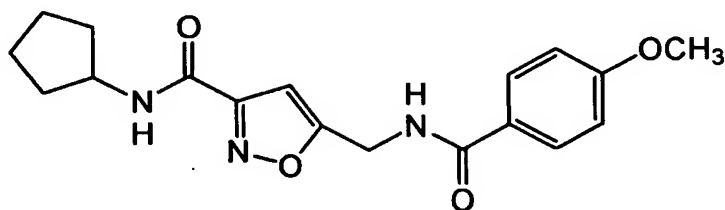
実施例 18 (168) : N-[(3-tert-ブチルアミノカルボニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-119) :



融点：128～129℃。

実施例18 (169) : N-[(3-シクロペンチルアミノカルボニル-5-イソオキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-120) :

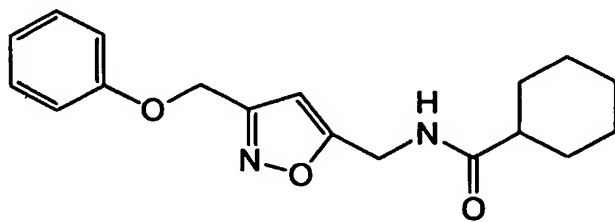
5



融点：138～140℃。

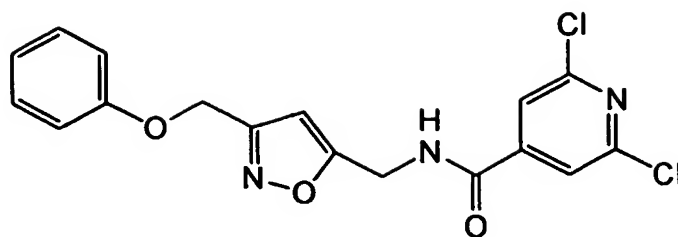
実施例18 (170) : N-[(3-フェノキシメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]シクロヘキサンカーボキサミドの製造 (化合物番号 IV-121) :

10



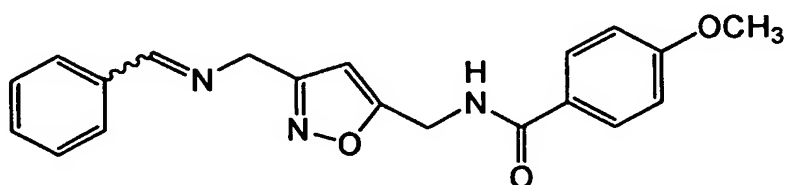
融点：86～93℃。

実施例18 (171) : N-[(3-フェノキシメチル-5-イソオキサゾリル)メチル]-2,6-ジクロロピリジン-4-カーボキサミドの製造 (化合物番号 IV-122) :



融点：93～99℃。

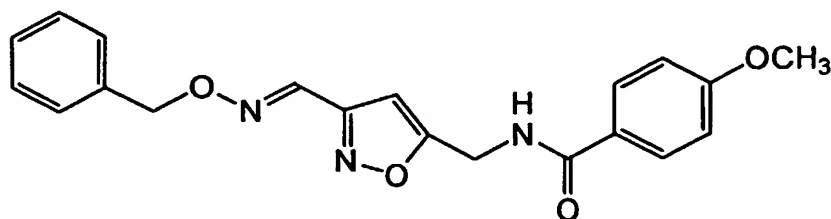
- 実施例 18 (172) : N-[(3-ベンジルイミノメチル-5-イソキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-123) :



性状：アモルファス，

NMR : δ 3.74(3H, s), 4.66(2H, d), 4.74(2H, s), 6.23(1H, s), 6.84(2H, d), 7.13-7.89(7H, m), 8.35(1H, s)。

- 10 実施例 18 (173) : N-[(3-ベンジルオキシイミノメチル-5-イソキサゾリル)メチル]-4-メトキシ安息香酸アミドの製造 (化合物番号 IV-124) :



NMR : δ 3.82(3H, s), 4.71(2H, d), 5.19(2H, s), 6.51(1H, s), 6.74(1H, br),

6.89(2H, d), 7.18-7.45(5H, m), 7.75(2H, d), 8.15(1H, s)。

[製剤例]

製剤例 1

I-25の化合物16質量部、ベンナイト28質量部、タルク52質量部、
5 ドデシルベンゼンスルホン酸ソーダ2質量部及びリグニンスルホン酸ソーダ
2質量部を混合、粉碎し、水約20質量部を加えて、混練機で練った後、造
粒機を通して造粒し、次いで乾燥整粒して粒剤を得た。

製剤例 2

II-3の化合物20質量部、珪藻土30質量部、クレー36質量部、ホワ
10 イトカーボン5質量部、リグニンスルホン酸ソーダ4質量部及びアルキルナ
フタレンスルホン酸ソーダ5質量部を混合粉碎して水和剤を得た。

製剤例 3

III-12の化合物20質量部、カオリンクレー65質量部及びタルク15
質量部をよく混合、粉碎して20%粉剤を得た。

15 製剤例 4

IV-8の化合物12.5質量部、エチレングリコール4質量部、ソルポー
ル3940（商品名：東邦化学製）5質量部、ルノックス1000C（商品
名：東邦化学製）1質量部、水77質量部をよく混合し、平均粒径5 μ m以
下になるまで湿式粉碎した後、キサントガム0.5質量部を混合し、フロ
20 アブル剤を得た。

製剤例 5

I-28の化合物20質量部、ポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル14質量部、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム10質量部及びキシレン56質量部を混合して乳剤を得た。

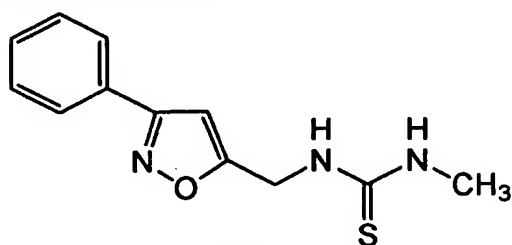
5 製剤例 6

- II-100の化合物17質量部、塩化カリウム79.5質量部、ニューカルゲンFS-1（商品名：竹本油脂株式会社製）を2質量部、デキストリン1質量部及びキサントガム0.5質量部を混和し、水20質量部を加えて、混練機で練った後、造粒機を通して造粒し、次いで乾燥整粒して粒剤を得、
 10 これを水溶性フィルムで作製した袋状の容器に充填し、充填口をヒートシールにより閉じジャンボ剤を得た。

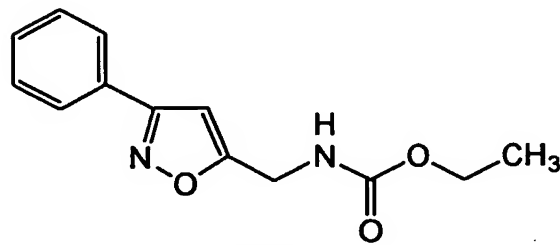
[試験例]

次に本発明化合物の農園芸用殺菌剤としての試験例を記載する。

- 15 なお、比較薬剤として特開昭52-154525号公報に記載の下記化合物A及びBを用いた。



化合物 A



化合物 B

試験例 1 イネいもち病に対する効果試験

製剤例 2 に準じて調製した本発明化合物製剤を、水で希釈して 200 p p

- mに調製したのち、直径6 cmのプラスチック製の鉢にて育成した3葉期のイネ（品種：コシヒカリ、15本植え）にスプレーガンにて十分量散布した。翌日イネいもち病菌（*Pyricularia oryzae*）孢子懸濁液を噴霧接種した。ポットを22℃湿室下に24時間保持した後、温室内に7日間放置し、第3葉の病斑数を肉眼調査し、表5に示す基準により評価した。その結果を表6に示す。

表 5

評価	病斑面積歩合 (%)
5	0
4	1 ~ 5
3	6 ~ 10
2	11 ~ 20
1	21 ~ 41
0	41 以上

表 6-1 : イネいもち病に対する効果

化合物No.	実施例番号	評価	化合物No.	実施例番号	評価
I-4	17(1)	5	II-106	18(12)	3
I-6	17(2)	5	II-108	18(14)	1
I-8	18(3)	3	II-110	18(16)	1
I-25	17(3)	5	II-112	18(18)	3
I-26	5	5	II-113	18(19)	2
I-27	17(4)	5	II-114	18(20)	3
I-28	1	4	II-115	18(21)	3
I-29	17(5)	5	III-2	17(29)	4
I-30	17(6)	5	III-4	17(30)	3
I-31	12	4	III-5	9	4
I-32	17(7)	5	III-6	17(31)	5
I-33	17(8)	5	III-10	17(32)	5
I-38	17(9)	5	III-11	17(33)	5
I-41	17(10)	3	III-12	17(34)	5
I-45	17(12)	4	III-13	17(35)	5
I-47	17(14)	4	III-14	17(36)	5
I-48	17(15)	4	III-17	17(37)	5
I-49	17(16)	3	III-18	7	5
I-63	18(2)	2	III-19	17(38)	5
I-64	18(4)	2	III-26	17(39)	5
II-2	6	5	III-27	17(40)	5
II-3	17(17)	3	III-28	17(41)	5
II-7	11	5	III-31	17(42)	5
II-9	17(19)	5	III-34	17(43)	5
II-10	18(9)	4	III-37	17(44)	5
II-12	3	4	III-40	17(45)	5
II-13	17(20)	5	III-43	17(46)	5
II-14	17(21)	4	III-49	17(47)	5
II-15	17(22)	3	III-51	17(48)	5
II-48	17(23)	3	III-52	17(49)	5
II-49	17(24)	4	III-57	17(51)	2
II-50	17(25)	5	III-61	17(52)	5
II-99	17(26)	3	III-65	17(53)	5
II-100	17(27)	4	III-66	17(54)	5
II-104	18(10)	5	III-67	17(55)	5
II-105	18(11)	2	III-68	17(56)	5

表 6-2 : イネいもち病に対する効果

化合物No.	実施例番号	評価	化合物No.	実施例番号	評価
Ⅲ-73	17(57)	5	Ⅲ-223	18(38)	5
Ⅲ-74	17(58)	5	Ⅲ-224	18(42)	2
Ⅲ-107	17(59)	5	Ⅲ-225	18(43)	4
Ⅲ-108	17(60)	2	Ⅲ-227	18(45)	5
Ⅲ-109	17(61)	4	Ⅲ-228	18(46)	4
Ⅲ-111	4	5	Ⅲ-229	18(47)	5
Ⅲ-121	17(62)	5	Ⅲ-230	18(48)	5
Ⅲ-122	17(63)	4	Ⅲ-231	18(49)	5
Ⅲ-123	17(64)	5	Ⅲ-232	18(50)	3
Ⅲ-124	17(65)	5	Ⅲ-235	18(53)	4
Ⅲ-130	17(66)	4	Ⅲ-236	18(54)	4
Ⅲ-133	17(67)	4	Ⅲ-237	18(55)	3
Ⅲ-134	17(68)	3	Ⅲ-238	18(56)	4
Ⅲ-137	17(69)	4	Ⅲ-240	18(59)	2
Ⅲ-139	17(70)	5	Ⅲ-243	18(62)	2
Ⅲ-156	17(71)	4	Ⅲ-245	18(64)	5
Ⅲ-162	17(72)	5	Ⅲ-246	18(65)	3
Ⅲ-174	17(73)	4	Ⅲ-247	18(66)	5
Ⅲ-177	17(76)	4	Ⅲ-248	18(67)	3
Ⅲ-180	17(77)	5	Ⅲ-249	18(68)	2
Ⅲ-201	17(78)	5	Ⅲ-250	18(69)	2
Ⅲ-203	18(40)	2	Ⅲ-251	18(70)	5
Ⅲ-204	18(37)	2	Ⅲ-252	18(71)	5
Ⅲ-208	17(80)	4	Ⅲ-253	18(72)	5
Ⅲ-210	17(82)	5	Ⅲ-255	18(74)	4
Ⅲ-212	18(26)	2	Ⅲ-256	18(75)	5
Ⅲ-213	18(27)	3	Ⅲ-257	18(76)	3
Ⅲ-214	18(28)	4	Ⅲ-258	18(77)	5
Ⅲ-215	18(29)	5	Ⅲ-259	18(78)	5
Ⅲ-216	18(30)	4	Ⅲ-262	18(81)	5
Ⅲ-217	18(31)	4	Ⅲ-263	18(82)	5
Ⅲ-218	18(32)	3	Ⅲ-264	18(83)	5
Ⅲ-219	18(33)	3	Ⅲ-265	18(84)	5
Ⅲ-220	18(34)	3	Ⅲ-275	18(94)	2
Ⅲ-221	18(35)	2	Ⅳ-1	17(84)	5
Ⅲ-222	18(36)	3	Ⅳ-2	17(85)	5

表 6-3 : イネいもち病に対する効果

化合物No.	実施例番号	評価	化合物No.	実施例番号	評価
IV-3	17(86)	5	IV-84	18(131)	5
IV-4	17(87)	4	IV-86	18(133)	5
IV-5	17(88)	4	IV-87	18(135)	5
IV-6	17(89)	5	IV-88	18(136)	3
IV-8	17(91)	3	IV-89	18(137)	5
IV-9	17(92)	5	IV-90	18(138)	3
IV-10	17(93)	5	IV-91	18(139)	3
IV-11	17(94)	5	IV-92	18(140)	4
IV-12	8	5	IV-93	18(141)	4
IV-29	17(96)	3	IV-94	18(142)	2
IV-33	17(97)	5	IV-95	18(143)	4
IV-34	17(98)	5	IV-96	18(144)	4
IV-35	17(99)	5	IV-97	18(145)	5
IV-40	17(100)	3	IV-98	18(146)	2
IV-44	18(158)	5	IV-99	18(147)	4
IV-45	10	5	IV-104	18(152)	4
IV-46	17(101)	5	IV-105	18(153)	3
IV-47	16	5	IV-106	18(154)	2
IV-48	17(102)	3	IV-107	18(155)	5
IV-49	17(103)	2	IV-108	18(156)	2
IV-50	17(104)	5	IV-110	18(159)	5
IV-51	17(105)	2	IV-111	18(160)	3
IV-52	17(106)	3	IV-112	18(161)	2
IV-53	17(107)	5	IV-113	18(162)	4
IV-54	17(108)	3	IV-114	18(163)	5
IV-55	17(109)	4	IV-115	18(164)	5
IV-56	17(110)	3	IV-116	18(165)	5
IV-57	17(111)	5	IV-117	18(166)	4
IV-58	17(112)	5	IV-119	18(168)	2
IV-59	17(113)	5	IV-120	18(169)	3
IV-60	17(114)	5	IV-121	18(170)	4
IV-72	17(115)	2	IV-122	18(171)	3
IV-73	18(119)	2	IV-123	18(172)	2
IV-74	17(116)	4	IV-124	18(173)	5
IV-75	18(120)	2	化合物A		0
IV-80	18(127)	4	化合物B		0

試験例 2 キュウリ炭疽病に対する効果試験

- 5 製剤例 2 に準じて調製した本発明化合物製剤を、水で希釈して 200 ppm に調製したのち、直径 6 cm のプラスチックポットにて育成した 3 葉期のキュウリ（品種：ときわ光 3 号 P 型）の第 1 葉と第 2 葉にスプレーガンにて十分量散布した。翌日キュウリ炭疽病菌（*Colletotrichum lagenarium*）孢子懸濁液を噴霧接種した。ポットを 22℃ 温室下に 24 時間保持した後、温室内に 7 日間放置し、第 1 葉と第 2 葉の病斑面積率を肉眼調査し、表 5 と同様の基準により評価した。その結果を表 7 に示す。

表 7-1 : キュウリ炭疽病菌に対する効果

化合物No.	実施例番号	評価	化合物No.	実施例番号	評価
I-4	17(1)	5	III-11	17(33)	3
I-6	17(2)	5	III-12	17(34)	5
I-8	18(3)	3	III-13	17(35)	5
I-26	5	5	III-14	17(36)	3
I-27	17(4)	5	III-17	17(37)	5
I-28	1	5	III-18	7	5
I-29	17(5)	5	III-19	17(38)	5
I-30	17(6)	5	III-26	17(39)	5
I-33	17(8)	5	III-27	17(40)	5
I-38	17(9)	5	III-28	17(41)	4
I-41	17(10)	4	III-31	17(42)	5
I-45	17(12)	4	III-34	17(43)	5
I-47	17(14)	4	III-37	17(44)	3
I-64	18(4)	3	III-40	17(45)	5
II-7	11	5	III-43	17(46)	4
II-9	17(19)	5	III-49	17(47)	5
II-10	18(9)	5	III-51	17(48)	4
II-12	3	4	III-52	17(49)	5
II-13	17(20)	5	III-61	17(52)	4
II-14	17(21)	5	III-65	17(53)	5
II-15	17(22)	4	III-66	17(54)	5
II-48	17(23)	4	III-67	17(55)	5
II-100	17(27)	4	III-68	17(56)	5
II-104	18(10)	5	III-73	17(57)	4
II-106	18(12)	2	III-74	17(58)	5
II-108	18(14)	2	III-107	17(59)	5
II-110	18(16)	1	III-108	17(60)	3
II-112	18(18)	3	III-109	17(61)	5
II-113	18(19)	1	III-111	4	5
II-114	18(20)	3	III-121	17(62)	5
II-115	18(21)	2	III-122	17(63)	4
III-2	17(29)	4	III-123	17(64)	5
III-4	17(30)	4	III-124	17(65)	4
III-5	9	4	III-130	17(66)	4
III-6	17(31)	4	III-133	17(67)	4
III-10	17(32)	5	III-134	17(68)	5

表 7-2 : キュウリ炭疽病菌に対する効果

化合物No.	実施例番号	評価	化合物No.	実施例番号	評価
Ⅲ-137	17(69)	5	Ⅲ-246	18(65)	3
Ⅲ-139	17(70)	5	Ⅲ-247	18(66)	5
Ⅲ-156	17(71)	4	Ⅲ-248	18(67)	2
Ⅲ-162	17(72)	5	Ⅲ-249	18(68)	2
Ⅲ-174	17(73)	4	Ⅲ-250	18(69)	2
Ⅲ-177	17(76)	4	Ⅲ-251	18(70)	5
Ⅲ-180	17(77)	5	Ⅲ-252	18(71)	5
Ⅲ-201	17(78)	5	Ⅲ-253	18(72)	5
Ⅲ-204	18(37)	2	Ⅲ-255	18(74)	4
Ⅲ-208	17(80)	4	Ⅲ-256	18(75)	5
Ⅲ-210	17(82)	5	Ⅲ-257	18(76)	4
Ⅲ-214	18(28)	5	Ⅲ-258	18(77)	4
Ⅲ-215	18(29)	5	Ⅲ-259	18(78)	4
Ⅲ-216	18(30)	4	Ⅲ-262	18(81)	5
Ⅲ-217	18(31)	4	Ⅲ-263	18(82)	5
Ⅲ-218	18(32)	4	Ⅲ-264	18(83)	5
Ⅲ-219	18(33)	3	Ⅲ-265	18(84)	4
Ⅲ-220	18(34)	3	Ⅲ-275	18(94)	2
Ⅲ-221	18(35)	2	Ⅳ-1	17(84)	5
Ⅲ-222	18(36)	2	Ⅳ-2	17(85)	5
Ⅲ-223	18(38)	5	Ⅳ-3	17(86)	5
Ⅲ-224	18(42)	2	Ⅳ-4	17(87)	4
Ⅲ-225	18(43)	4	Ⅳ-9	17(92)	5
Ⅲ-227	18(45)	5	Ⅳ-10	17(93)	5
Ⅲ-228	18(46)	3	Ⅳ-11	17(94)	5
Ⅲ-229	18(47)	5	Ⅳ-12	8	5
Ⅲ-230	18(48)	5	Ⅳ-29	17(96)	3
Ⅲ-231	18(49)	5	Ⅳ-33	17(97)	5
Ⅲ-232	18(50)	2	Ⅳ-34	17(98)	5
Ⅲ-235	18(53)	4	Ⅳ-35	17(99)	5
Ⅲ-236	18(54)	4	Ⅳ-40	17(100)	2
Ⅲ-237	18(55)	3	Ⅳ-44	18(158)	5
Ⅲ-238	18(56)	5	Ⅳ-45	10	5
Ⅲ-240	18(59)	2	Ⅳ-46	17(101)	5
Ⅲ-243	18(62)	1	Ⅳ-47	16	5
Ⅲ-245	18(64)	5	Ⅳ-48	17(102)	2

表 7-3 : キュウリ炭疽病菌に対する効果

化合物No.	実施例番号	評価	化合物No.	実施例番号	評価
IV-49	17(103)	2	IV-95	18(143)	4
IV-50	17(104)	4	IV-96	18(144)	4
IV-52	17(106)	2	IV-97	18(145)	5
IV-53	17(107)	5	IV-99	18(147)	4
IV-54	17(108)	4	IV-104	18(152)	4
IV-55	17(109)	4	IV-105	18(153)	3
IV-56	17(110)	2	IV-107	18(155)	5
IV-57	17(111)	5	IV-108	18(156)	2
IV-58	17(112)	5	IV-110	18(159)	5
IV-59	17(113)	5	IV-111	18(160)	3
IV-60	17(114)	5	IV-112	18(161)	3
IV-72	17(115)	3	IV-113	18(162)	4
IV-73	18(119)	3	IV-114	18(163)	5
IV-74	17(116)	3	IV-115	18(164)	5
IV-75	18(120)	3	IV-116	18(165)	4
IV-80	18(127)	4	IV-117	18(166)	4
IV-84	18(131)	5	IV-119	18(168)	3
IV-86	18(133)	5	IV-120	18(169)	2
IV-87	18(135)	4	IV-121	18(170)	4
IV-88	18(136)	3	IV-122	18(171)	2
IV-89	18(137)	5	IV-123	18(172)	2
IV-90	18(138)	3	IV-124	18(173)	5
IV-92	18(140)	3	化合物A		0
IV-93	18(141)	3	化合物B		0
IV-94	18(142)	3			

試験例 3 トマト疫病に対する効果試験

有効成分化合物を、0.01% Tween 20を含む水で希釈して125
 5 ppmに調製した。本薬液200L/10a相当量を、直径6cmのプラスチックポットにて育成した5葉期のトマト（品種：シュガーランプ）にスプレーガンにて散布した。翌日トマト疫病菌（*Phytophthora infestans*）遊走子のう懸濁液を噴霧接種した。ポットを22℃温室下に16時間保持した後、

温室内に3日間放置し、第三、四および五本葉の発病面積率を肉眼調査し、表5と同様の基準により評価した。その結果を表8に示す。

表8：トマト疫病に対する効果

化合物No.	実施例番号	評価
I-65	18(5)	4
I-67	18(8)	2
II-105	18(11)	5
II-107	18(13)	4
II-111	18(17)	5
II-115	18(21)	3
III-2	17(29)	5
III-3	15	2
III-226	18(44)	3
III-233	18(51)	2
III-254	18(73)	5
III-260	18(79)	3
III-261	18(80)	2
III-266	18(85)	1
III-267	18(86)	5
III-268	18(87)	0
III-269	18(88)	5
III-270	18(89)	2
III-271	18(90)	1
III-272	18(91)	5
III-273	18(92)	0
III-274	18(93)	4
III-277	18(96)	4
III-278	18(97)	4
III-279	18(98)	5
IV-78	18(125)	1
化合物A		0
化合物B		0

5 試験例4 ウリ類べと病に対する効果試験

有効成分化合物を、0.01% Tween 20を含む水で希釈して125

- p p mに調製した。本薬液 200 L / 10 a 相当量を、直径 6 c m のプラスチックポットにて育成した 3 葉期のキュウリ（品種：光 3 号 P 型）にスプレーガンにて散布した。翌日キュウリべと病（*Pseudoperonospora cubensis*）遊走子懸濁液を噴霧接種した。ポットを 22℃ 温室下に 18 時間保持した後、
- 5 温室内に 3 日間放置し、第一および二本葉の発病面積率を肉眼調査し、表 5 と同様の基準により評価した。その結果を表 9 に示す。

表 9：ウリ類べと病に対する効果試験

化合物No.	実施例番号	評価
I-65	18(5)	2
II-105	18(11)	4
II-107	18(13)	2
II-111	18(17)	3
II-115	18(21)	1
III-2	17(29)	5
III-3	15	4
III-204	18(37)	4
III-222	18(36)	4
III-226	18(44)	4
III-254	18(73)	3
III-267	18(86)	5
III-269	18(88)	5
III-272	18(91)	3
III-274	18(93)	2
III-277	18(96)	2
III-278	18(97)	2
III-279	18(98)	3
化合物A		0
化合物B		0

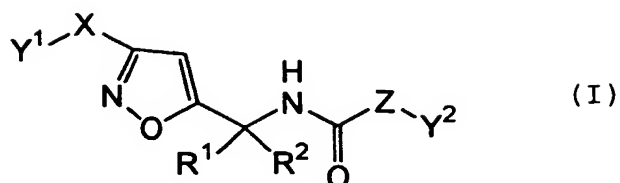
10 産業上の利用可能性

一般式 (I) または (I A) で示される置換イソキサゾールアルキルアミ

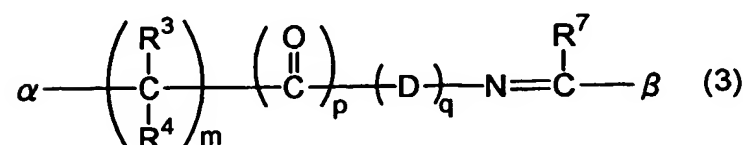
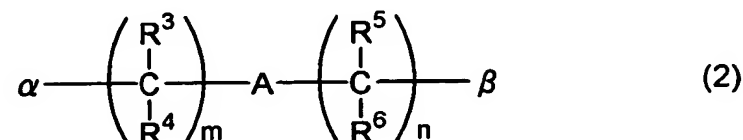
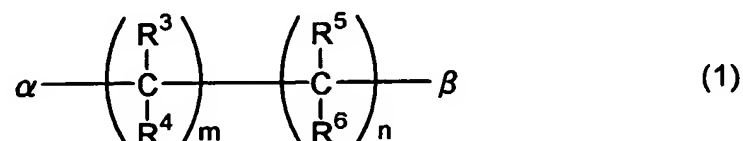
ン誘導体は、低薬量で植物病害、特にイネいもち病、キュウリ炭疽病に対して防除の効果を示し、作物に対しては安全であり農園芸用の殺菌剤として有用である。

請求の範囲

1. 一般式 (I)



- [式中、 R^1 及び R^2 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基またはシアノ基を表わし、または R^1 と R^2 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、
- 10 Xは次式 (1)、(2) または (3)



(式中、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アル

キニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^3 と R^4 及び R^5 と R^6 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

Aは、酸素原子、硫黄原子、 $-S(O)-$ 基、 $-S(O)_2-$ 基、 $-NR^{12}$ 基（基中、 R^{12} は水素原子または低級アルキル基を表わす。）、カルボニル基、 $-NH-CO-$ 基、 $-CO-NH-$ 基、 $-C\equiv C-$ 基、 $-NH-CO-NH-$ 基、 $-O-CONH-$ 基、 $-HC=N-$ 基または



（基中、 R^{14} および R^{15} はそれぞれ水素原子または低級アルキル基を表わす。）を表わし、

m及びnはそれぞれ0または1～3の整数を表わし、

p及びqはそれぞれ0または1を表わし、

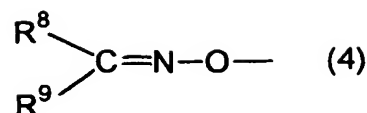
15 R^7 は、水素原子または低級アルキル基を表わし、

Dは酸素原子または $-NH-$ 基を表わす。

なお、 α は Y^1 側に結合し、 β はイソキサゾール環側に結合するものとする。）で示される基を表わし、

20 Y^1 は、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族へ

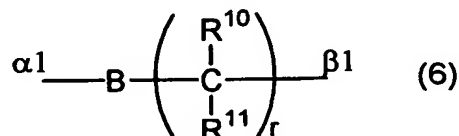
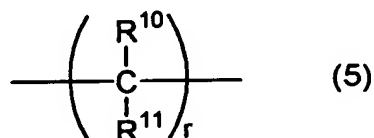
テロ環または次式 (4)



(式中、 R^8 及び R^9 はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいフェニル基を表わし、または R^8 と R^9 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよい。)を表わし、

Y^2 は置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環を表わし、

Zは、次式 (5) または (6)



(式中、 R^{10} 及び R^{11} は、同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^{10} と R^{11} が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

r は0または1～3の整数を表わし、

Bは酸素原子、硫黄原子または $-\text{NR}^{13}-$ 基 (式中、 R^{13} は水素原子また

は低級アルキル基を表わす。)を表わす。

なお、 α 1 及び β 1 はいずれが Y^2 側に結合してもよい。)で示される基を表わす。

ただし、以下の (1) ~ (3) を除く：

- 5 (1) Xが単結合(式(1)においてm及びnが0の場合)であり、 Y^1 が4-ヒドロキシ-3, 5-ジ-tert-ブチルフェニル基を表わす化合物、
- (2) (2-1) Zが単結合(式(5)においてrが0の場合)であるとき、もしくは(2-2) ZがNH基(式(6)においてr=0でBが-NH-基を表わす場合)のとき、 R^1 及び R^2 が水素原子を表わし、Xが単結合(式(1)
- 10 においてm及びnが0の場合)であり、 Y^1 及び Y^2 が共に無置換のフェニル基を表わす化合物、
- (3) R^1 及び R^2 が水素原子を表わし、Zが単結合(式(5)においてrが0の場合)を表わし、 Y^2 が置換されていてもよい4-ヒドロキシシンノリン-3-イル基を表わす化合物。]
- 15 で示される置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

2. 請求項1に記載の一般式(I)において、 R^1 及び R^2 が互いに独立して、それぞれ水素原子、または置換されていてもよい低級アルキル基を表わす請求項1に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

3. 請求項1に記載の一般式(I)において、Zが酸素原子であり(式
- 20 (6)においてrが0でBが酸素原子の場合)、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす請求項2に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

4. 請求項 1 に記載の一般式 (I) において、Z が $-NR^{13}-$ 基 (基中、 R^{13} は、水素原子または低級アルキル基を表わす。) (式 (6) において r が 0 で B が $-NR^{13}-$ 基の場合) を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす請求項 2 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。
5. 請求項 1 に記載の一般式 (I) において、X 及び Z が単結合 (式 (1) において m 及び n が 0 であり、式 (5) において r が 0 の場合) であり、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす請求項 2 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。
6. 請求項 1 に記載の一般式 (I) において、X が式 (1) で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、 $m+n$ が 1、2 または 3 である請求項 2 に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。
7. 請求項 1 に記載の一般式 (I) において、X が式 (2) で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が

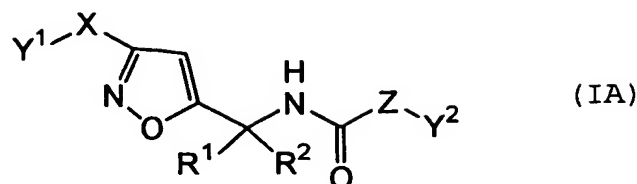
置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、 n が1または2であり、 $m+n$ が1、2または3である請求項2に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

- 5 8. 請求項1に記載の一般式(I)において、 X が式(2)で示される基を表わし、基中の R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、また
- 10 は置換されていてもよいシクロアルキル基を表わし、 n が0であり、 m が0、1または2である請求項2に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

9. 請求項1に記載の一般式(I)において、 X が式(3)で示される基を表わし、基中の R^3 及び R^4 が同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、
- 15 置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルコキシ基、ハロゲン原子またはシアノ基を表わし、 $m=0$ 、1または2を表わし、 Y^2 が置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、または置換されていてもよいシクロアルキル基を表わす請求項2に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

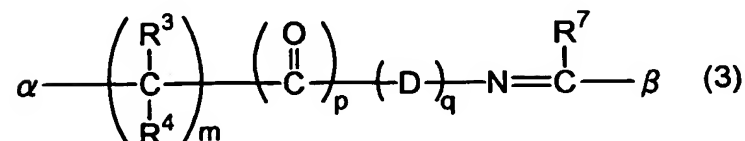
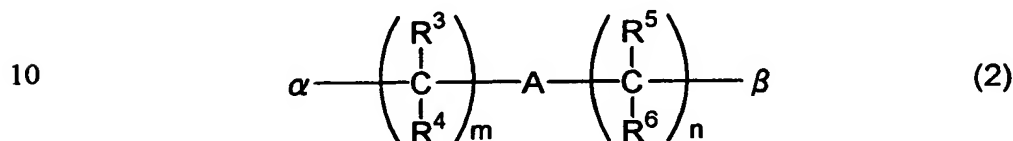
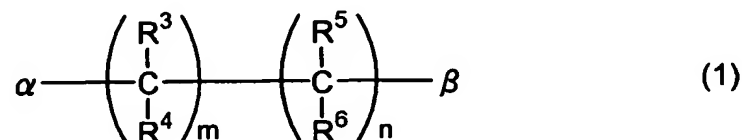
- 20 10. 請求項1に記載の一般式(I)において、 Y^1 がハロゲン原子で置換されたメチル基を表わし、 Z が単結合(式(1)において m および n が0である場合)である請求項2に記載の置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体。

11. 一般式 (IA)



[式中、 R^1 及び R^2 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、ハロゲン原子、水酸基、カルボキシル基またはシアノ基を表わし、または R^1 と R^2 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

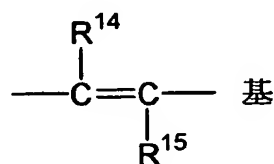
Xは次式 (1)、(2) または (3)



(式中、 R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基

を表わし、または R^3 と R^4 及び R^5 と R^6 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

Aは、酸素原子、硫黄原子、 $-S(O)-$ 基、 $-S(O)_2-$ 基、 $-NR^{12}$ 基（基中、 R^{12} は水素原子または低級アルキル基を表わす。）、カルボニル基、 $-NH-CO-$ 基、 $-CO-NH-$ 基、 $-C\equiv C-$ 基、 $-NH-CO$
 5 $NH-$ 基、 $-O-CONH-$ 基、 $-HC=N-$ 基または



（基中、 R^{14} および R^{15} はそれぞれ水素原子または低級アルキル基を表わす。）を表わし、

10 m 及び n はそれぞれ0または1～3の整数を表わし、

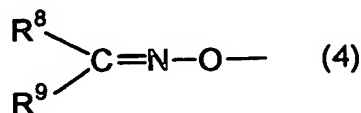
p 及び q はそれぞれ0または1を表わし、

R^7 は、水素原子または低級アルキル基を表わし、

Dは酸素原子または $-NH-$ 基を表わす。

なお、 α は Y^1 側に結合し、 β はイソキサゾール環側に結合するものとする。）で示される基を表わし、
 15

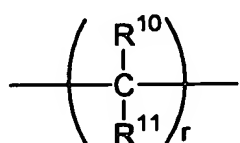
Y^1 は、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換
 20 されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環または次式(4)



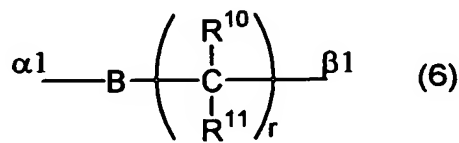
(式中、 R^8 及び R^9 はそれぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいフェニル基を表わし、または R^8 と R^9 が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよい。)を表わし、

- 5 Y^2 は置換されていてもよい低級アルケニル基、置換されていてもよい低級アルキニル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいシクロ低級アルケニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよいナフチル基、置換されていてもよいヘテロアリール基、または置換されていてもよい脂肪族ヘテロ環を表わし、

- 10 Zは、次式(5)または(6)



(5)



(6)

- (式中、 R^{10} 及び R^{11} は、同一でも異なってもよく、それぞれ水素原子、置換されていてもよい低級アルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルキルチオ基、アミノ基、低級アルキルアミノ基、ジ低級アルキルアミノ基、ハロゲン原子、水酸基またはシアノ基を表わし、または R^{10} と R^{11} が一緒になって置換されていてもよいシクロアルキル基を形成してもよく、

r は0または1～3の整数を表わし、

- Bは酸素原子、硫黄原子または $-NR^{13}-$ 基(式中、 R^{13} は水素原子または低級アルキル基を表わす。)を表わす。

なお、 $\alpha 1$ 及び $\beta 1$ はいずれが Y^2 側に結合してもよい。)で示される基を表わす。]

で示される置換イソキサゾールアルキルアミン誘導体を有効成分として含有

する農園芸用殺菌剤。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/02632

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D261/08, 413/04, 413/12, 417/04, 417/12, 413/06,
A01N43/80, 47/12, 47/18, 47/22, 47/28, 47/30, 47/32,
47/36, 47/38

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D261/08, 413/04, 413/12, 417/04, 417/12, 413/06,
A01N43/80, 47/12, 47/18, 47/22, 47/28, 47/30, 47/32,
47/36, 47/38

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Jitsuyo Shinan Koho 1992-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2002
Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2002 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2002

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
REGISTRY (STN), CAPLUS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	US 4109002 A (Eli Lilly and Co.), 22 August, 1978 (22.08.78), Claims; example 14 & DE 2723688 A & FR 2354708 A & GB 1580162 A & JP 52-154525 A	1, 2, 10, 11 3-9
X A	PEI, Y. et al., Regioselective Syntheses of 3-Aminomethyl-5-substituted Isoxazoles: A Facile and Chemoselective Reduction of Azide to Amine by Sodium Borohydride Using 1,3-Propanedithiol as A Catalyst., Tetrahedron Letters, 1993, Vol.34, No.47, pages 7509 to 7512, Compound 13a, 13b	1, 2 3-11

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"&" document member of the same patent family
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search
24 April, 2003 (24.04.03)

Date of mailing of the international search report
20 May, 2003 (20.05.03)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/02632

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHIARINO, D. et al., A CONVENIENT SYNTHESIS OF MUSCIMOL BY A 1,3-DIPOLAR CYCLOADDITION REACTION, Tetrahedron Letters, 1986, Vol.27, No.27, pages 3181 to 3182, Compound 4	1,2
X	GOMBOS, Z. et al., Synthesis of Some New Isoxazolylic Acid Derivatives, J.CHEM.SOC.PERKIN TRANS. 1, 1993, No.1, pages 139 to 143, Compounds 14, 15	1,2
X	SEWALD, N. et al., Synthese 2-Heteroaryl-substituierter 3,3,3-Trifluoralanin- und 3,3,3-Trifluormilchsaure-Derivate, Liebigs Annalen der chemie, 1992, No.9, pages 947 to 952, Compound 3	1,2
A	GB 2114566 A (Sandoz Ltd.), 24 August, 1983 (24.08.83), Full text & DE 3303388 A & FR 2523967 A & JP 58-148868 A	1-11
A	EP 10166 A1 (BAYER AG.), 30 April, 1980 (30.04.80), Full text & DE 2842315 A & JP 55-45698 A	1-11
A	EP 761654 A1 (American Cyanamid Co.), 12 March, 1997 (12.03.97), Full text & US 5780393 A	1-11

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D261/08, 413/04, 413/12, 417/04, 417/12, 413/06, A01N43/80, 47/12, 47/18, 47/22, 47/28, 47/30, 47/32, 47/36, 47/38

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl⁷ C07D261/08, 413/04, 413/12, 417/04, 417/12, 413/06, A01N43/80, 47/12, 47/18, 47/22, 47/28, 47/30, 47/32, 47/36, 47/38

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

日本国実用新案公報 1992-1996年
日本国公開実用新案公報 1971-2002年
日本国実用新案登録公報 1996-2002年
日本国登録実用新案公報 1994-2002年

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

REGISTRY (STN), CAPLUS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	US 4109002 A (Eli Lilly and Company) 1978.08.22, Claims, EXAMPLE 14 & DE 2723688 A & FR 2354708 A & GB 1580162 A & JP 52-154525 A	1, 2, 10, 11 3-9
X A	PEI, Y. et al, Regioselective Syntheses of 3-Aminomethyl- 5-substituted Isoxazoles: A Facile and Chemoselective Reduction of Azide to Amine by Sodium Borohydride Using 1,3-Propanedithiol as A Catalyst., Tetrahedron Letters, 1993, Vol. 34, No. 47, p.7509-7512, Compound 13a, 13b	1, 2 3-11

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの
「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの
「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)
「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献
「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの
「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの
「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

24.04.03

国際調査報告の発送日

20.05.03

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

伊藤 幸司



4C

3127

電話番号 03-3581-1101 内線 3451

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	CHIARINO, D. et al, A CONVENIENT SYNTHESIS OF MUSCIMOL BY A 1,3-DIPOLAR CYCLOADDITION REACTION, Tetrahedron Letters, 1986, Vol. 27, No. 27, p. 3181-3182, Compound 4	1, 2
X	GOMBOS, Z. et al, Synthesis of Some New Isoxazolylacetic Acid Derivatives, J. CHEM. SOC. PERKIN TRANS. 1, 1993, No. 1, p. 139-143, Compound 14, 15	1, 2
X	SEWALD, N. et al, Synthese 2-Heteroaryl-substituierter 3,3,3-Trifluoralanin- und 3,3,3-Trifluormilchsäure-Derivate, Liebigs Annalen der chemie, 1992, No. 9, p. 947-952, Compound 3	1, 2
A	GB 2114566 A (Sandoz Ltd) 1983.08.24, 全文 & DE 3303388 A & FR 2523967 A & JP 58-148868 A	1-11
A	EP 10166 A1 & (BAYER Aktiengesellschaft) 1980.04.30, 全文 & DE 2842315 A & JP 55-45698 A	1-11
A	EP 761654 A1 (American Cyanamid Company) 1997.03.12., 全文 & US 5780393 A	1-11